



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21), (22) Заявка: 96105902/04, 29.07.1994

(24) Дата начала действия патента: 29.07.1994

(30) Приоритет: 11.08.1993 DE P4326908.7

(43) Дата публикации заявки: 10.06.1998

(45) Опубликовано: 10.08.2005 Бюл. № 22

(56) Список документов, цитированных в отчете о
поиске: JP 02001484, 05.01.1990. EP 242081
A1, 21.10.1987. EP 528681 A1, 24.02.1993. EP
56161 A1, 21.07.1982. SU 791751, 03.01.1981.
RU 2127256 C1, 10.03.1999. SU 727103 A,
05.04.1980.

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 11.03.1996

(86) Заявка РСТ:
EP 94/02533 (29.07.1994)

(87) Публикация РСТ:
WO 95/04728 (16.02.1995)

Адрес для переписки:
103064, Москва, ул. Казакова, 16, НИИР -
Канцелярия "Патентные поверенные Квашнин,
Сапельников и партнеры", В.П.Квашнину

(72) Автор(ы):

КРЮГЕР Бернд-Виланд (DE),
АССМАНН Лутц (DE),
ГАЙЕР Херберт (AT),
ГЕРДЕС Петер (DE),
ХАЙНЕМАНН Ульрих (DE),
КУНТ Дитмар (DE),
ФИЛИПП Ульрих (DE),
ЗАЙТЦ Томас (DE),
ШТЕТТЕР Ерг (DE),
ТИМАНН Ральф (DE),
ДЕНЕ Хайнц-Вильгельм (DE),
ДУТЦМАНН Штефан (DE),
ХЭНССЛЕР Герд (DE)

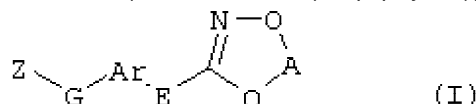
(73) Патентообладатель(ли):

БАЙЕР АГ (DE)

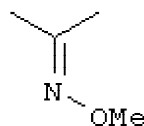
(54) ЗАМЕЩЕННЫЕ АЗАДИОКСОЦИКЛОАЛКЕНЫ, СПОСОБЫ ИХ ПОЛУЧЕНИЯ,
ПРОМЕЖУТОЧНЫЕ ПРОДУКТЫ, ФУНГИЦИДНЫЕ СРЕДСТВА И СПОСОБ ИХ ПОЛУЧЕНИЯ,
СПОСОБ БОРЬБЫ С НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫМИ ГРИБАМИ

(57) Реферат:

Описываются замещенные
азадиоксоциклоалкены общей формулы (I)



где А - диметилен, незамещенный или
замещенный метилом, Ar - орто-фенилен,
незамещенный или замещенный фтором,
тиофендиил или пиридиндиил, Е - группа формулы



G - кислород, группы -O-CH₂-, -CH₂-O-
или -C(CH₃)=N-O-CH₂-, Z - фенил, пиримидинил
или тиадиазолил, незамещенные или замещенные,
или нафтил. Описываются 4 способа получения
соединений формулы (I), 5 видов промежуточных
продуктов для получения соединений формулы (I),
фунгицидные средства, содержащие в качестве
активного вещества соединения формулы (I),
способ получения фунгицидных средств, способ

борьбы с нежелательными грибами, использующий
соединение формулы (I). Технический результат -
соединения формулы (I) проявляют фунгицидные

свойства, что позволяет использовать их в
сельском хозяйстве. 13 н.п. ф-лы, 5 табл.

RU 2 2 5 8 0 6 6 C 2

RU 2 2 5 8 0 6 6 C 2



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,
PATENTS AND TRADEMARKS

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(21), (22) Application: 96105902/04, 29.07.1994
(24) Effective date for property rights: 29.07.1994
(30) Priority: 11.08.1993 DE P4326908.7
(43) Application published: 10.06.1998
(45) Date of publication: 10.08.2005 Bull. 22
(85) Commencement of national phase: 11.03.1996
(86) PCT application:
EP 94/02533 (29.07.1994)
(87) PCT publication:
WO 95/04728 (16.02.1995)

Mail address:
103064, Moskva, ul. Kazakova, 16, NIIR -
Kantsel'arija "Patentnye poverennye
Kvashnin, Sapel'nikov i partnery", V.P.Kvashninu

(72) Inventor(s):
KRJuGER Bernd-Viland (DE),
ASSMANN Lutts (DE),
GAJER Kherbert (AT),
GERDES Peter (DE),
KhAJNEMANN Ul'rikh (DE),
KUNT Ditmar (DE),
FILIPP Ul'rikh (DE),
ZAJTTs Tomas (DE),
ShTETTER Erg (DE),
TIMANN Ral'f (DE),
DENE Khajnts-Vil'khel'm (DE),
DUTTSMANN Shtefan (DE),
KhEhNSSLER Gerd (DE)

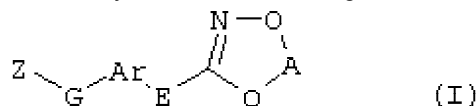
(73) Proprietor(s):
BAJER AG (DE)

(54) SUBSTITUTED AZADIOXOCYCLOALKENES, METHODS FOR THEIR PREPARING,
INTERMEDIATE COMPOUNDS, FUNGICIDE AGENTS AND METHOD FOR THEIR PREPARING,
METHOD FOR CONTROL OF HARMFUL FUNGI

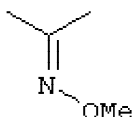
(57) Abstract:

FIELD: organic chemistry, chemical technology, agriculture.

SUBSTANCE: invention describes substituted azadioxocycloalkenes of the general formula (I):



wherein A means unsubstituted or methyl-substituted dimethylene; Ar means unsubstituted or fluorine-substituted ortho-phenylene, thiophendiy or pyridindiy; E means group of the formula:



wherein G means oxygen

atom, groups -O-CH₂-, -CH₂-O- or -C(CH₃)=N-O-CH₂-; Z means unsubstituted or substituted phenyl, pyrimidinyl or thiadiazolyl, or naphthyl. Invention describes 4 methods for preparing compounds of the formula (I), 5 species of intermediate compounds used for preparing compounds of the formula (I), fungicide agents comprising compound of the formula (I) as an active substance, a method for preparing fungicide agents, method for control of harmful fungi using compound of the formula (I). Compounds of the formula (I) show fungicide properties and therefore they can be used in agriculture.

EFFECT: improved preparing methods, valuable properties of compounds.

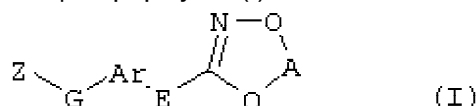
13 cl, 5 tbl, 18 ex

Настоящее изобретение относится к новым замещенным диоксазинам, обладающим фунгицидной активностью, более конкретно к замещенным азиадиксоциклоалкенам, способам их получения, промежуточным продуктам, фунгицидным средствам и способу их получения.

Известны замещенные 5,6-дигидро-1,4,2-диоксазины, обладающие фунгицидной активностью (см. JP-A-02001484 или Chemical Abstracts, vol.113, №.1, 02.07.1990, abstract №.6381 y).

Задачей изобретения является расширение ассортимента замещенных диоксазинов, проявляющих фунгицидную активность.

Поставленная задача решается предлагаемыми замещенными азиадиксоциклоалкенами общей формулы (I)

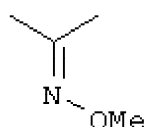


где

A - диметилен (этан-1,2-диил), незамещенный или замещенный метилом,

Ar - орто-фенилен, незамещенный или замещенный фтором, тиофендиил или пиридиндиил,

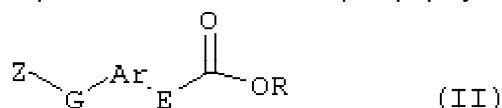
E - группа формулы



G - кислород, группы -O-CH₂-, -CH₂-O- или -C(CH₃)=N-O-CH₂-,

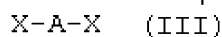
Z - фенил, пиримидинил или тиадизолил, незамещенные или одно- или двукратно замещенные заместителями из группы, включающей метил, этил, n- или изопропил, n-, изо-, втор- или трет.бутил, метокси, этокси, трифторметил, трифторметокси, дифторметокси, фтор, хлор, бром, метилтио, этилтио, H₃C-O-N=CH-, бензилокси, нафтилокси, пиридинил, пиридинилтио, пиридинилокси, бензилтио, незамещенный или замещенный хлором или метилом, тиенил, незамещенный или замещенный метилом, фенил, незамещенный или замещенный 1 или 2 одинаковыми или различными заместителями из группы, включающей метил, этил, метокси, этокси, дифторметилокси, трифторметил, фтор, хлор и бром, фенокси-группу, незамещенную или замещенную 1 или 2 одинаковыми или различными заместителями из группы, включающей фтор, хлор, бром, циано, метил, метокси, этил, дифторметилокси, трифторметил, метокси-карбонил и диметиламиносульфонил, и фенилтио-группу, незамещенную или замещенную однократно фтором, хлором или бромом, или Z означает нафтил.

Замещенные азиадиксоциклоалкены вышеприведенной общей формулы (I), где A, Ar, E, G и Z имеют вышеуказанные значения, можно получать за счет того, что производные карбоновой кислоты общей формулы (II)



где

Ar, E, G и Z имеют вышеуказанные значения, а R представляет собой C₁-C₄-алкил, подвергают взаимодействию с гидроксиламином или его галоидводородной солью, при необходимости, в присутствии акцептора кислоты и, при необходимости, в присутствии разбавителя, полученный продукт подвергают взаимодействию с двузамещенными алканами общей формулы (III)



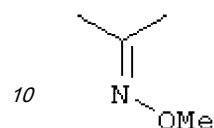
где

A имеет вышеуказанное значение,

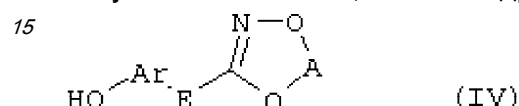
X - галоген, алкилсульфонилокси или фенилсульфонилокси; при необходимости, в присутствии акцептора кислоты и, при необходимости, в присутствии разбавителя, с последующим выделением целевого продукта.

В нижеследующем данный способ обозначается как способ а).

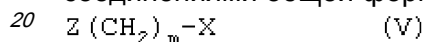
5 Замещенные азиноксациклоалкены вышеприведенной общей формулы (I), где А означает диметилен (этан-1,2-диил), Ar означает орто-фенилен, Е означает группу формулы



G означает кислород или группу -CH₂-O- и Z означает фенил, пиримидинил, замещенные метилом, этилом, фтором, хлором, бромом, феноксигруппу, замещенную циано, можно получать за счет того, что гидроксиарилы общей формулы (IV)



где А, Ar и Е имеют вышеуказанные значения, подвергают взаимодействию с соединениями общей формулы (V)



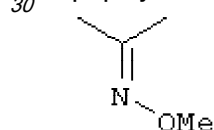
где

Z имеет вышеуказанные значения, m означает 0 или 1, а X означает галоген, при необходимости, в присутствии акцептора кислоты и, при необходимости, в присутствии разбавителя, с последующим, в случае необходимости, переводением группы Z в

25 желаемое значение и выделением целевого продукта.

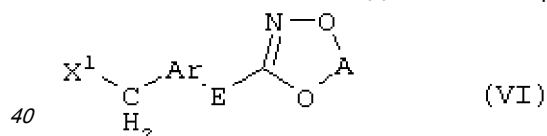
В нижеследующем данный способ обозначается как способ б).

Замещенные азиноксациклоалкены вышеприведенной общей формулы (I), где А означает диметилен (этан-1,2-диил), Ar означает орто-фенилен, Е означает группу формулы



G - группа -CH₂-O-,

35 Z - фенил, замещенный метилом или этилом, можно получать за счет того, что галогенметилы общей формулы (VI)



где

А, Ar и Е имеют вышеуказанные значения, а X¹ означает галоген, подвергают взаимодействию с соединениями общей формулы (VII)

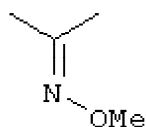


где Z имеет вышеуказанное значение,

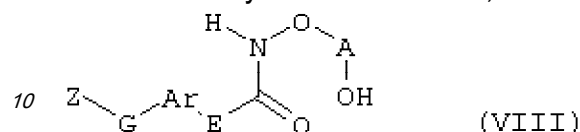
при необходимости, в присутствии акцептора кислоты и, при необходимости, в присутствии разбавителя, с последующим выделением целевого продукта.

В нижеследующем данный способ обозначается как способ в).

50 Замещенные азиноксациклоалкены вышеприведенной общей формулы (I), где А означает диметилен (этан-1,2-диил), Ar означает орто-фенилен, Е означает группу формулы



- 5 G - группа $-\text{CH}_2-\text{O}-$,
 Z - фенил, замещенный метилом или этилом,
 можно получать за счет того, что гидроксилалкиамиды общей формулы (VIII)



где

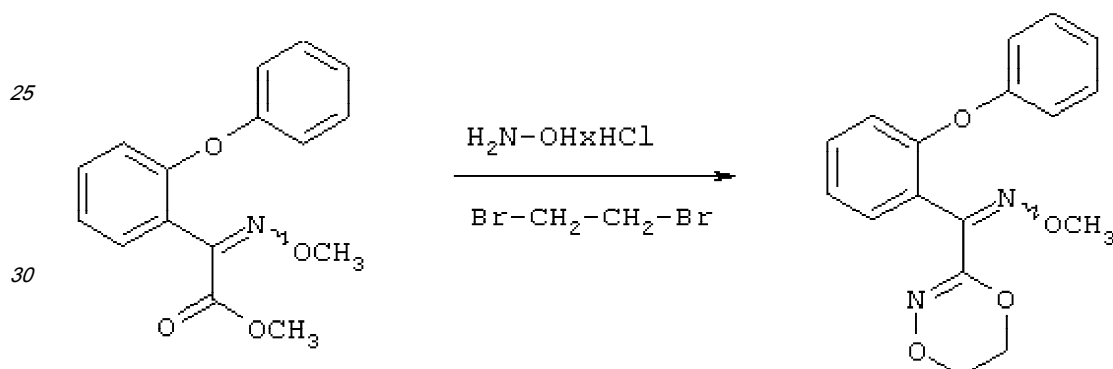
A, Ar, E, G и Z имеют вышеуказанные значения,

- 15 подвергают циклизации водоудаляющим средством, при необходимости, в присутствии
 разбавителя, с последующим выделением целевого продукта.

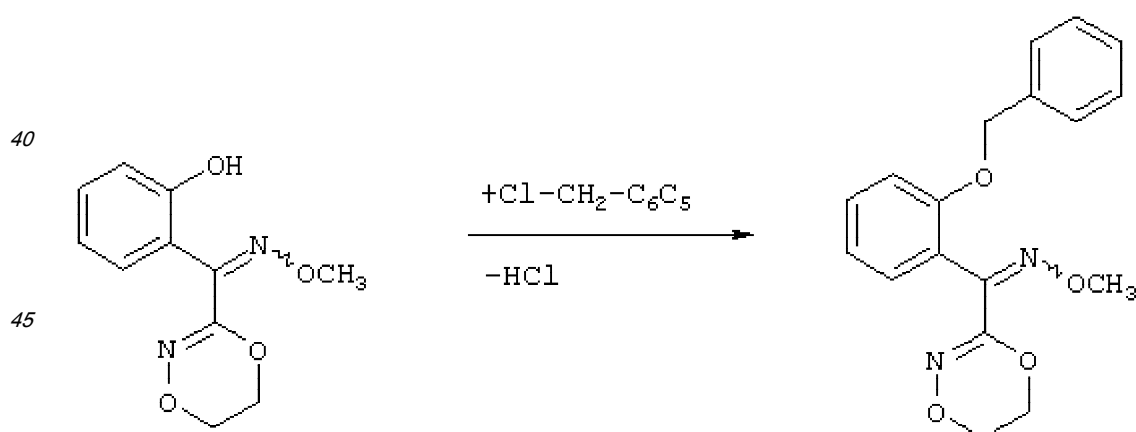
В нижеследующем данный способ обозначается как способ г).

Проведение способов а)-г), представляющих собой дополнительный объект данного изобретения, поясняются следующими данными.

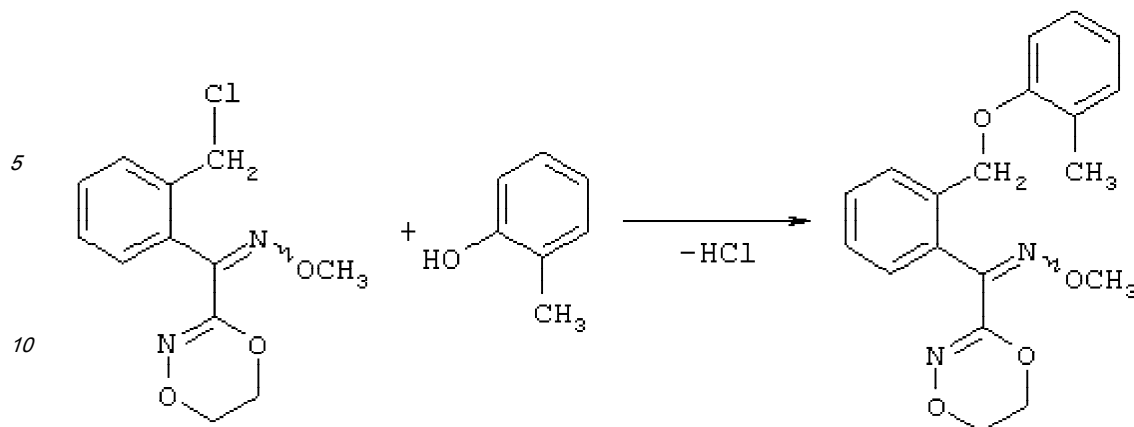
- 20 В случае, если в качестве исходных веществ используют, например, сложный
 метиловый эфир α -метоксимино- α -(2-фенокси-фенил)-уксусной кислоты, гидрохлорид
 гидроксиламина и 1,2-дибромэтан, то реакция по предлагаемому способу (а) протекает по
 следующей реакционной схеме:



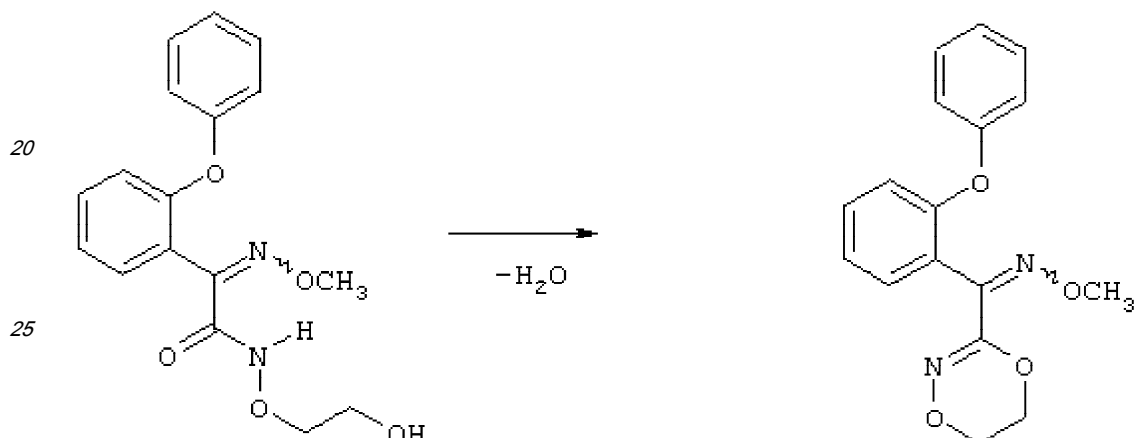
- 35 В случае, если в качестве исходных веществ используют, например, 3-метоксимино-(2-
 гидрокси-фенил)-метил]-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазин и бензилхлорид, то реакция по
 предлагаемому способу (б) протекает по следующей реакционной схеме:



- 50 В случае, если в качестве исходных веществ используют, например, 3-метоксимино-(2-
 хлорметил-фенил)-метил]-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазин и 2-метилфенол, то реакция по
 предлагаемому способу (в) протекает по следующей реакционной схеме:



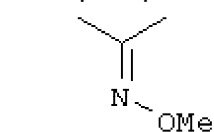
В случае, если в качестве исходного соединения используют, например, н-(2-гидрокси-этокси)-метоксимино-(2-фенокси-фенил)-ацетамид, то реакция по предлагаемому способу (г) протекает по следующей реакционной схеме:



Исходные вещества формулы (II) известны или их можно получать известными способами (см. заявки 178826, 242081, 382375, 493711).

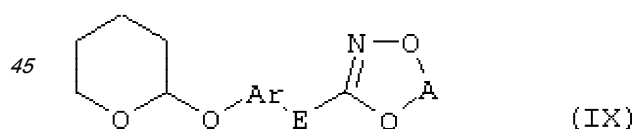
Исходные вещества формулы (III) представляют собой известные химикаты органических синтезов.

Исходные вещества формулы (IV) из литературы не известны. Поэтому дальнейшим объектом изобретения являются соединения формулы (II), где А означает диметилен, Ar - орто-фенилен и Е - группу формулы



в качестве промежуточных продуктов для соединений формулы (II).

Новые гидроксиарилловые соединения формулы (IV) получают за счет того, что тетрагидропиранилокси-соединения общей формулы (IX)



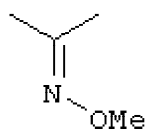
где

А, Ar и Е имеют вышеуказанные значения,

подвергают взаимодействию с кислотой, такой, как, например, соляная кислота, метансульфоновая кислота, бензолсульфоновая кислота, п-толуолсульфоновая кислота, или с кислым ионообменником, при необходимости в присутствии разбавителя, такого, как, например, вода, метанол, этанол или сложный эфир уксусной кислоты, при

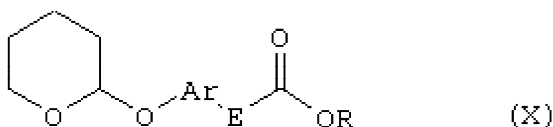
температуре 0-100°C (см. нижепредставленные примеры).

Тетрагидропиранилокси-соединения формулы (IX) из литературы не известны. Поэтому дальнейшим объектом изобретения являются соединения формулы (IX), где А означает диметилен (этан-1,2-диил), Ar - орто-фенилен, Е - группу формулы



в качестве промежуточных продуктов для соединений формулы (I).

Новые тетрагидропиранилокси-соединения формулы (IX) получают за счет того, что сложные эфиры общей формулы (X)



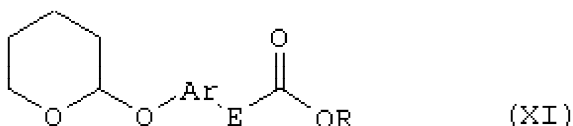
где

Ar, E и R имеют вышеуказанные значения,

подвергают взаимодействию с гидроксиламином или его гидрохлоридом, при

необходимости в присутствии акцептора кислоты, такого, как, например, гидроокись калия, и, при необходимости, в присутствии разбавителей, таких, как, например, метанол и вода, и образовавшийся при этом промежуточный продукт in situ подвергают взаимодействию с диалогеналканами вышеприведенной общей формулы (III), при необходимости в присутствии акцептора кислоты, такого, как, например, карбонат калия, при температуре 0-100°C (см. описание предлагаемого способа (а) и нижепредставленные примеры).

Новые сложные эфиры формулы (X) из литературы не известны. Их можно получать за счет того, что сложные эфиры тетрагидропиранилокси-фенил-уксусной кислоты общей формулы (XI)

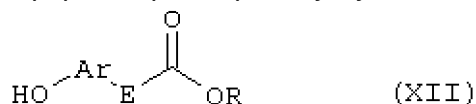


где

Ar и R имеют вышеуказанные значения,

подвергают дериватизации обычными методами (см. нижепредставленные примеры).

Новые сложные эфиры тетрагидропиранилокси-фенил-уксусной кислоты общей формулы (XI) из литературы не известны. Их можно получать за счет того, что сложные эфиры гидроксифенилуксусной кислоты общей формулы (XII)



где

Ar и R имеют вышеуказанные значения,

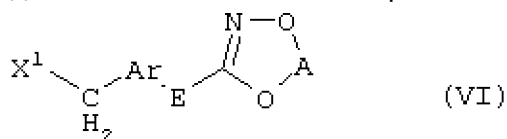
подвергают взаимодействию с дигидропираном, при необходимости в присутствии катализатора, такого, как, например, п-толуолсульфоновая кислота, и, при необходимости, в присутствии разбавителя, такого, как, например, тетра-гидрофуран, при температуре 0-100°C (см. нижепредставленные примеры).

Исходные вещества формулы (XII) представляют собой известные химикаты органических синтезов.

Используемые в предлагаемом способе (б) в качестве дальнейшего реагента

соединения формулы (V) представляют собой известные химикаты органических синтезов.

Используемые в предлагаемом способе (в) в качестве исходного вещества галогенметилловые соединения формулы (VI) из литературы не известны. Поэтому дальнейшим объектом изобретения являются соединения формулы (VI),

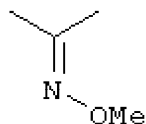


где

10 A - диметилен (этан-1,2-диил),

Ar - орто-фенилен,

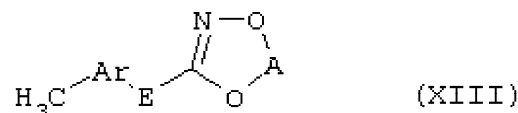
E - группа формулы



X¹ - галоген,

в качестве промежуточных продуктов для соединений формулы (I).

Новые галогенметилловые соединения формулы (VI) получают за счет того, что метилловые соединения общей формулы (XIII)



где

25 A, Ar и E имеют вышеуказанные значения,

подвергают взаимодействию с агентом галогенирования, таким, как, например, N-бром- или N-хлор-сукцинимид, при необходимости в присутствии катализатора, такого, как, например, азоизобутиронитрил, и, при необходимости, в присутствии разбавителя, такого, как, например, тетрахлорметан, при температуре 0-150°C (см. нижепредставленные

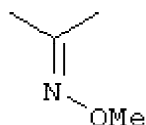
30 примеры). Метилловые соединения формулы (XIII) из литературы не известны. Поэтому дополнительным объектом изобретения являются соединения формулы (XIII),

где

35 A - диметилен (этан-1,2-диил),

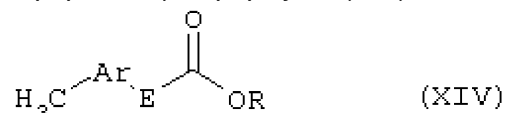
Ar - орто-фенилен,

E - группа формулы



в качестве промежуточных продуктов для соединений формулы (I).

Новые метилновые соединения формулы (XIII) получают за счет того, что сложные эфиры общей формулы (XIV)



где

50 где Ar, E и R имеют вышеуказанные значения,

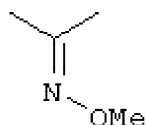
подвергают последовательному взаимодействию с гидроксиламином или его гидрохлоридом, при необходимости, в присутствии акцептора кислоты, такого, как, например, гидроокись калия, и, при необходимости, в присутствии разбавителя, такого,

как, например, метанол, и с дизамещенным алканом вышеприведенной общей формулы (III), при необходимости, в присутствии акцептора кислоты, такого, как, например, карбоната калия, при температуре 0-150°C (см. нижепредставленные примеры).

Соединения формулы (XIV) известны или их можно получать известными способами (см. заявки EP 386561, 498188, нижепредставленные примеры).

Используемые в предлагаемом способе (в) в качестве исходного вещества соединения формулы (VII) представляют собой известные химикаты органических синтезов.

Используемые в предлагаемом способе (г) в качестве исходного вещества гидроксиалкоксиамиды формулы (VIII) из литературы не известны. Поэтому еще одним объектом изобретения являются соединения формулы (VIII), где А означает диметилен (этан-1,2-диил), Ar - орто-фенилен, Е - группу формулы

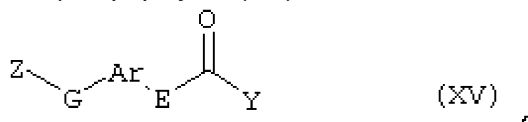


G - группу -CH₂-O-,

Z - фенил, замещенный метилом,

в качестве промежуточных продуктов для соединений формулы (I).

Новые гидроксиалкоксиамиды формулы (VIII) получают за счет того, что производные общей формулы (XV)

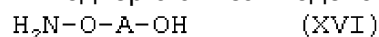


где

Ar, E, G и Z имеют вышеуказанные значения, и

Y означает галоген, гидрокси или алкокси,

подвергают взаимодействию с гидроксиламиной общей формулы (XVI)



где

A имеет вышеуказанное значение,

при необходимости, в присутствии акцептора кислоты, такого, как, например, триэтиламин, пиридин или 4-диметиламино-пиридин, и, при необходимости, в присутствии разбавителя, такого, как, например, метиленхлорид, толуол или тетрагидрофуран, при температуре 0-150°C (см. заявки EP 178826, 242081, 493711).

Производные формулы (XV) известны или их можно получать известными способами (см. J. Chem. Soc. Perkin Trans. I 1987, 2829-2823).

Предлагаемые способы (а), (б) и (в) проводят предпочтительно в присутствии акцептора кислоты. В качестве акцепторов кислоты пригодны все органические или неорганические основания. К ним принадлежат, например, гидриды щелочноземельных металлов или щелочных металлов, гидроокиси щелочноземельных металлов или щелочных металлов, амиды щелочноземельных металлов или щелочных металлов, алколяты щелочноземельных металлов или щелочных металлов, ацетаты щелочноземельных металлов или щелочных металлов, карбонаты щелочноземельных металлов или щелочных металлов или гидрокарбонаты щелочноземельных металлов или щелочных металлов, такие, как, например, гидрид натрия, амид натрия, метилат натрия, этилат натрия, трет. бутилат калия, гидроокись натрия, гидроокись калия, гидроокись аммония, ацетат натрия, ацетат калия, ацетат кальция, ацетат аммония, карбонат натрия, карбонат калия, гидрокарбонат калия, гидрокарбонат натрия или карбонат аммония, а также трет. амины, такие, как, например, триметиламин, триэтиламин, трибутиламин, N,N-диметиланилин, N,N-диметил-бензиламин, пиридин, N-метилпиперидин, N,N-диметиламинопиридин, диазабициклооктан, диазабициклононен или диазабициклоундецен.

В качестве разбавителя для проведения предлагаемых способов (а), (б) и (в) используют воду и органические растворители. К ним принадлежат, в частности, алифатические, алициклические или ароматические, при необходимости галогенированные углеводороды, такие, как, например, бензин, бензол, толуол, ксилол, хлорбензол, дихлорбензол, простой петролейный эфир, гексан, циклогексан, дихлорметан, хлороформ или четыреххлористый углерод, простые эфиры, такие, как, например, диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран или этиленгликоль-диметиловый или этиленгликольдиэтиловый эфиры; кетоны, такие, как, например, ацетон, бутанон или метил-изобутил-кетон; нитрилы, такие, как, например, ацетонитрил, пропионитрил или бензонитрил; амиды, такие, как, например, N,N-диметилформамид, N,N-диметилацетамид, N-метилформанилид, N-метилпирролидон или триамид гексаметилфосфорной кислоты; сложные эфиры, такие, как, например, сложный метиловый эфир уксусной кислоты или сложный этиловый эфир уксусной кислоты; сульфоксиды, как, например, диметилсульфоксид, спирты, такие, как, например, метанол, этанол, н.- или изопропанол, простой этиленгликольмонометиловый эфир, простой этиленгликольмоноэтиловый эфир, простой диэтиленгликоль-монометиловый эфир, простой диэтиленгликоль-моноэтиловый эфир, их смеси с водой или чистая вода.

Предлагаемый способ (г) проводят предпочтительно в присутствии средства дегидратации. При этом в качестве средства дегидратации в частности пригодны обычные водоудаляющие химикаты, в частности ангидриды кислоты, такие, как, например, фосфорный ангидрид.

В качестве разбавителя для проведения предлагаемого способа (г) используют общепринятые инертные органические растворители. К ним принадлежат, в частности, алифатические, алициклические или ароматические, при необходимости галогенированные углеводороды, такие, как, например, бензин, бензол, толуол, ксилол, хлорбензол, дихлорбензол, простой петролейный эфир, гексан, циклогексан, дихлорметан, хлороформ или четыреххлористый углерод, простые эфиры, такие, как, например, диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран или этиленгликоль-диметиловый или этиленгликольдиэтиловый эфиры; кетоны, такие, как, например, ацетон, бутанон или метилизобутилкетон; нитрилы, такие, как, например, ацетонитрил, пропионитрил или бензонитрил;

амиды, такие, как, например, N,N-диметилформамид, N,N-диметилацетамид, N-метилформанилид, N-метилпирролидон или триамид гексаметилфосфорной кислоты; сложные эфиры, такие, как, например, сложный метиловый эфир уксусной кислоты или сложный этиловый эфир уксусной кислоты; сульфоксиды, как, например, диметилсульфоксид.

Температура реакции при проведении предлагаемых способов (а) - (г) может колебаться в широких пределах. Обычно работают при температуре -20-+200°C, предпочтительно при температуре 0-150°C.

Для проведения предлагаемого способа (а) на 1 моль производного карбоновой кислоты формулы (II) обычно используют 1-5 моль, предпочтительно 1,0-2,5 моль, гидроксиламина или его галоидводородной соли и обычно 1-1 моль, предпочтительно 1,0-5,0 моль, дизамещенного алкана формулы (III).

Для проведения предлагаемого способа (б) на 1 моль гидроксиларилового соединения формулы (IV) обычно используют 0,5-2,0 моль, предпочтительно 0,9-1,2 моль, соединения формулы (V).

Для проведения предлагаемого способа (в) на 1 моль галогенированного соединения формулы (VI) обычно используют 1-5 моль, предпочтительно 1,5-3 моль, соединения формулы (VII).

Для проведения предлагаемого способа (г) на 1 моль гидроксиалкоксамиды формулы (VIII) обычно используют 1-5 моль, предпочтительно 1,5-4 моль, средства дегидратации.

Реакции, переработку реакционных смесей и выделение целевых продуктов осуществляют известными приемами (см. нижепредставленные примеры).

Предлагаемые соединения вышеприведенной формулы (I) могут иметься в качестве смесей различных изомерных форм, в частности, E- и Z-изомеров. Используют как E-, так и Z-изомеры, а также смеси этих изомеров в любой форме.

Предлагаемые соединения проявляют фунгицидную активность. Фунгицидные средства, которые являются дальнейшим объектом изобретения, используют для борьбы с плазмодиофоромицетами, оомицетами, хитридиомицетами, цигомицетами, аскомицетами, базидомицетами и дейтеромицетами.

В нижеследующем в качестве примера приводятся несколько возбудителей грибковых заболеваний, принадлежащих к вышеназванным семействам.

Виды *Pythium*, такие, как, например, *Pythium ultimum*, Виды *Phytophthora*, такие, как, например, *Phytophthora infestans*.

Виды *Pseudoperonospora*, такие, как, например, *Pseudoperonospora humuli* или *Pseudoperonospora cubense*.

Виды *Plasmopara*, такие, как, например, *Plasmopara viticola*.

Виды *Peronospora*, такие, как, например, *Peronospora pisi* или *Peronospora brassicae*.

Виды *Erysiphe*, такие, как, например, *Erysiphe graminis*.

Виды *Sphaerotheca*, такие, как, например, *Sphaerotheca fuliginea*.

Виды *Podosphaera*, такие, как, например, *Podosphaera leucotricha*.

Виды *Venturia*, такие, как, например, *Venturia inaequalis*.

Виды *Pyrenophora*, такие, как, например, *Pyrenophora teres* или *Pyrenophora graminea* (конидиальная форма: *Drechslera*, синоним: *Helminthosporium*).

Виды *Cochliobolus*, такие, как, например, *Cochliobolus sativus* (конидиальная форма: *Drechslera*, синоним: *Helminthosporium*).

Виды *Uromyces*, такие, как, например, *Uromyces appendiculatus*.

Виды *Puccinia*, такие, как, например, *Puccinia recondita*.

Виды *Tilletia*, такие, как, например, *Tilletia caries*.

Виды *Ustilago*, такие, как, например, *Ustilago nuda* или *Ustilago avenae*.

Виды *Pellicularia*, такие, как, например, *Pellicularia sasakii*.

Виды *Pyricularia*, такие, как, например, *Pyricularia oryzae*.

Виды *Fusarium*, такие, как, например, *Fusarium culmorum*.

Виды *Botrytis*, такие, как, например, *Botrytis cinerea*.

Виды *Septoria*, такие, как, например, *Septoria nodorum*.

Виды *Leptosphaeria*, такие, как, например, *Leptosphaeria nodorum*.

Виды *Cercospora*, такие, как, например, *Cercospora canescens*.

Виды *Alternaria*, такие, как, например, *Alternaria brassicae*.

Виды *Pseudocercospora*, такие, как, например, *Pseudocercospora herpotrichoides*.

Хорошая переносимость растениями активных веществ в необходимых для борьбы с болезнями растений концентрациях позволяет производить обработку надземных частей растений, посадочного и посевного материалов и почвы.

При этом предлагаемые активные вещества можно использовать особенно успешно для борьбы с болезнями в области плодоводства и овощеводства, как, например, с возбудителями *Phytophthora*, или для борьбы с болезнями хлебных злаков, например, для борьбы с возбудителями *Pyrenophora*.

Кроме того, предлагаемые активные вещества обладают хорошим действием, например, в борьбе с возбудителями *Erysiphe graminis*, *Cochliobolus sativus*, *Leptosphaeria nodorum*, *Pseudocercospora herpotrichoides* и с видами *Fusarium* на хлебных злаках, с возбудителями *Pyricularia oryzae* и *Pellicularia sasakii* на рисе. Они обладают также широким действием ин-витро.

Активные вещества можно переводить в стандартные препараты в зависимости от их физических и/или химических свойств, например, растворы, эмульсии, суспензии, порошки, пены, пасты, гранулы, аэрозоли, полимерные микрокапсулы и оболочки для посевного материала. Кроме того, они могут представлять собой препараты для чрезвычайно тонкого распределения в виде холодного и теплого тумана.

Эти препараты получают известными приемами, например, смешиванием активного вещества с наполнителями, например, с жидкими растворителями, находящимися под давлением сжиженными газами и/или твердыми носителями, при необходимости с применением поверхностно-активных веществ, например, эмульгаторов и/или

5 диспергаторов и/или пенообразователей. В случае использования воды в качестве наполнителя можно также применять органический растворитель в качестве вспомогательного средства. В качестве органического растворителя применяют в основном: ароматические углеводороды, такие, как, например, ксилол, толуол, или алкилнафталины, хлорированные ароматические и алифатические углеводороды, 10 например, хлорбензолы, хлорэтилены или метилхлорид, алифатические углеводороды, как циклогексан или парафины, например, нефтяные фракции, спирты, как бутанол или гликоль, а также их простые и сложные эфиры, кетоны, такие, как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон, сильно полярные растворители, как диметилформамид или диметилсульфоксид, а также вода. Под сжиженными 15 газообразными наполнителями или носителями следует понимать такие жидкости, которые при температуре окружающей среды и атмосферном давлении являются газообразными, например, рабочие газы для аэрозолей, такие, как, например, галогенированные углеводороды, а также бутан, пропан, азот и двуокись углерода.

В качестве твердых носителей применяют, например, натуральную породную муку, 20 такую, как каолин, глинозем, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтпориолонит или диатомная земля, и синтетическую породную муку, такую, как высокодисперсная кремневая кислота, окись алюминия и силикаты. В качестве твердых носителей для гранулятов применяют, например, измельченные и фракционированные природные каменные породы, такие, как кальцит, мрамор, пемза, сепиолит, доломит, синтетические неорганические и 25 органические муки, а также органические материалы, такие, как опилки, кожура кокосового ореха, початки кукурузы и стебли табака.

В качестве эмульгатора и/или пенообразователя применяют, например, неионогенные и анионные эмульгаторы, как сложные полиоксиэтиленовые эфиры жирных кислот, простые полиоксиэтиленовые эфиры жирных спиртов, например, акрил-арил-полигликолевый эфир, 30 алкилсульфонаты, алкилсульфаты, арилсульфонаты, а также белковые гидролизаты. В качестве диспергатора применяют, например, отработанный лигнинсульфитный щелок и метилцеллюлозу.

Препараты могут также содержать связующее, такое, как, например, карбокси-метилцеллюлоза, природные и синтетические порошкообразные, зернистые или латексные 35 полимеры, как, например, гуммиарабик, поливиниловый спирт, поливинилацетат, а также натуральные фосфолипиды, как кефалин и лецитин и синтетические фосфолипиды. Другими добавками могут быть минеральные и растительные масла.

Кроме того, препараты могут содержать еще красители, как, например, неорганические пигменты, например, окись железа, окись титана, ферроцианистый синий, и органические 40 красители, как ализарин, азо- и метилфталоцианиновые красители и питательные микроэлементы, такие, как соли железа, марганца, бора, меди, кобальта и олова.

Препараты содержат обычно 0,1-95 вес.% активного вещества, предпочтительно 0,5-90 вес.%.

Предлагаемые активные вещества можно применять как таковые или в виде их 45 препаратов, а также в виде смеси с известными фунгицидами, бактерицидами, акарицидами, нематоцидами или инсектицидами, например, в целях расширения спектра действия активных веществ или предотвращения устойчивости. Во многих случаях получается синергетический эффект, т.е. активность смеси превышает активность отдельных компонентов.

50 Особенно выгодными для сочетания с предлагаемыми активными веществами являются следующие соединения:

Фунгициды:

2-аминобутан; 2-анилино-4-метил-6-циклопропил-пиримидин; 2',6'-дибромо-2-метил-4'-

трифторметокси-4'-трифтор-метил-1,3-тиазолы-5-карбоксанилид; 2,6-ди-хлор-М-(4-трифторметилбензил)бензамид; (Е)-2-метоксиимино-М-метил-2-(2-феноксифенил)ацетамид; 8-гидроксихинолинсульфат; метил-(Е)-2-{2-[6-(2-цианофенокси)пиримидин-4-илокси]фенил}-3-метоксиакрилат; метил-(Е)-метоксимино[альфа-(о-толилокси)-о-толил]ацетат; 2-фенилфенол (ОРР), альдиморф, ампропил-фос, анилазин, азацоназол, беналаксил, беноданил, беномил, бинапакрил, бифенил, битертанол, бластицидин-S, бромуцоназолы, бупириматы, бутиобаты, полисульфид кальция, каптафол, каптан, карбендазим, карбоксин, хинометионат, хлоронеб, хлоропикрин, хлороталинил, хлостолинат, цуфранеб, цимоксанил, ципроцоназолы, ципрофурам, дихлорофен, диклобутразол, диклофлуанид, дикломезин, диклоран, диэтофенкарб, дифеноцоназол, диметиримол, диметоморф, диницоназол, динокап, дифениламин, дипиритион, диталимфос, дитианон, додин, дразоксолон, эдифенфос, эпоксицоназолы, этиримол, этридиазол, фенаримол, фенбуцоназолы, фенфурам, фенитропан, фенпиклонил, фенпропидин, фенпропиморф, фентинацетаты, фентингидроксид, фербам, феримзоны, флюазилам, флюдиоксонил, фторомиды, флюхинцоназолы, флюсилазолы, флюсульфамиды, флютоланил, флютриафол, фолпет, фосетил-алюминий, фталиды, фубери-дазол, фуралаксил, фурмециклокс, гуазатины, гексахлорбензол, гексацоназол, гимексазол, имизалил, имибенцоназол, иминоктадин, ипробенфос (IBR), ипродион, изопротиолан, казугамицин, приготовления меди, такие, как гидроокись меди, нафтенат меди, хлорокись меди, сернокислая медь, окись меди, медный оксин и бордосская смесь, мэн-коппер, манцозеб, манеб, мепанипирим, мепронил, металаксил, метцоназол, метасульфокарб, метфуроксам, метирам, метсульфовакс, миклобутанил, диметилдитиокарбамат никеля, нитротал-изопропил, нуаримол, офурацы, оксадиксил, оксамокарб, оксикарбоксин, пефуразоат, пенцоназол, пенцикурон, фосдифен, пимарицин, пипералин, полиоксин, пробеназол, прохлорац, процимидон, пропамокарб, пропицоназолы, пропиенеб, пиразофос, пирифенокс, пириметанил, пирохилон, хинтозен (PCNB), сера и приготовления серы, тебуцоназол, теклофталам, тецназен, тетрацоназол, тиабендазол, тициофен, тиофанат-метил, тирам, толхлофос-метил, толилфлюанид, триадимефон, триадименол, триазоксид, трихламид, трициклазол, тридеморф, трифлюмизол, трифорин, тритицоназол, валидамицин А, винхлозолин, зинеб, зирам. Бактерициды: бронопол, дифхлорофен, нитрапирин, диметилдитиокарабамат никеля, касугамицин, октилинон, фуранкарбоновая кислота, окситетрациклин, пробеназол, стрептомицин, теклофталам, сернокислая медь и другие приготовления меди. Инсектициды, акарициды, нематоды: абамектин, ацефат, акринатрин, аланикарб, альдикарб, алфаметрин, амитраз, авермектин, AZ 60541, азадирахтин, азинфос А, азинфос М, азоциклотин, *Bacillus thuringiensis*, 4-бromo-2-(4-хлорфенил)-1-(этоксиметил)-5-(трифторметил)-1Н-пирролы-3-карбонитрилы, бендиокарб, бенфуракарб, бенсультап, бетацил-утрин, бифентрин, ВРМС, брофенпрокс, бромфос А, буфенкарб, бупрофезин, бутокарбоксин, бутилпиридабен, кадусафос, карбарил, карбофуран, карбофенотион, карбосульфат, картап, хлорэтоккарб, хлорэтоксуфос, хлорэтоксифос, хлорфенвинфос, хлорфлюазурон, хлормефос, N-[(6-хлоро-3-пиридинил)-метил]-N'-циано-N-метилэтанамиды, хлорпирифос, хлорпирифос М, цис-ресметрин, клоцитрин, клофентезин, цианофос, циклопротрин, цифлутрин, цигалотрин, цигексатин, циперметрин, циромазин, дельтаметрин, деметон М, деметон S, деметон-S-метил, диафентиурон, диазинон, дихлофентион, дихлорфос, диклифос, дикротофос, диэтион, дифлубензурон, диметоат, диметилвинфос, диоксатион, дисульфотон,

эди́фенфос, эма́мектин, эсфе́нвалерат, этиофе́нкарб, этион, этофе́нпрокс, этопро́фос, этофе́нпрокс, э́тримфос, фена́минфос, фена́захин, фе́нбутатино́ксид, фе́нитро́тион, фе́нобука́рб, фе́нотиока́рб, фе́ноксика́рб, фе́нпропа́трин, фе́нпира́д, фе́нпиро́ксима́д, фе́нтион, фе́нвале́раты, фипро́нил, фла́узина́м, фла́узу́рон, фла́уцикло́сурон, фла́уцитри́нат, фла́уфе́ноксу́рон, фла́уфе́нпрокс, фла́ува́линаты, фо́нофос, фо́рмотион, фо́стиаза́т, фу́бфе́нпрокс, фу́ратиока́рб, НСН, гепте́нофос, гепа́флуму́рон, гепа́ситиазо́кс, ими́дакло́прид, ипро́бенфос, иза́зофос, изофе́нфос, изопро́карб, изо́ксатион, иве́мектин, ла́мда-цига́лотрин, лу́фену́рон, ма́латион, ме́карба́м, ме́рвинфос, ме́сульфе́нфос, ме́тальде́гид, ме́такри́фос, ме́тами́дофос, ме́тидатион, ме́тиока́рб, ме́томил, ме́толка́рб, ми́лбе́мектин, мо́нокрото́фос, мо́ксидеќтин, на́лед, НС 184, ни́тенпи́рам, оме́тоат, о́ксамил, о́кси́деме́тон М, о́кси́депро́фос, па́ратион А, па́ратион М, пе́рметрин, пе́нтоат, фо́рат, фо́сало́н, фо́смет, фо́сфамдо́н, фо́ксим, пи́рими́карб, пи́рими́фос М, пи́рими́фос А, про́фе́нофос, про́фе́нофос, про́ме́карб, про́па́фос, про́по́ксур, про́тио́фос, про́тоат, пи́метро́зин, пи́рахло́фос, пи́ракло́фос, пи́ракло́фос, пи́радафе́нтион, пи́ресме́трин, пи́ретру́м, пи́рида́бен, пи́римиди́фен, пи́рипро́кси́фен, хи́налфос, са́литион, се́буфос, си́лафто́фен, су́льфоте́п, су́льпро́фос, те́буфе́нози́ды, те́буфе́нпира́д, те́бупи́римфос, те́флу́бензу́рон, те́флу́трин, те́мефос, те́рба́м, те́рбу́фос, те́трахлорви́нфос, тиа́фено́кс, тиа́ди́карб, тиа́фано́кс, тиа́метон, тиа́назин, ту́рингиенси́н, тра́ломе́трин, тиа́ратен, тиа́зо́фос, тиа́зу́рон, три́хлорфо́н, три́флуму́рон, три́мета́карб, ва́мидотион, ХМС, кси́лилка́рб, YI 5301 /5302, зе́таме́трин.

Предлагаемые активные вещества могут иметься в препаратах также в смеси с другими известными активными веществами, такими, как гербициды, а также с удобрениями и регуляторами роста растений.

Активные вещества можно применять как таковые, в виде их препаратов или получаемых из них рабочих форм, таких, как, например, готовые к использованию растворы, суспензии, смачивающиеся порошки, пасты, растворимые порошки, средства для опыливания и грануляты. Их используют известными приемами, например, путем поливания, разбрызгивания, распыления, рассыпания, вспенивания, нанесения кистью и т.д. Кроме того, возможно применять активные вещества по методу обеспечения чрезвычайно тонкого распределения или же впрыскивания средства или же самого активного вещества в почву. Возможна и обработка посевного материала полезных растений.

При обработке частей полезных растений концентрация активного вещества в используемых препаратах может колебаться в широких пределах.

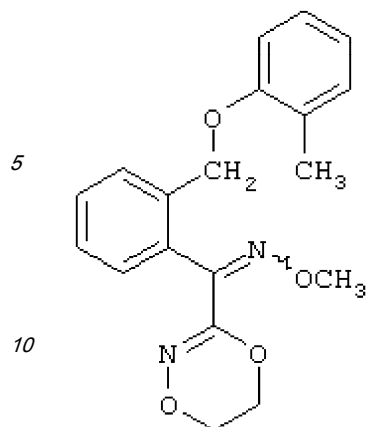
Она обычно составляет 1-0,0001 вес.%, предпочтительно 0,5-0,001 вес.%.

При обработке посевного материала обычно применяют 0,001-50 г активного вещества на кг посевного материала, предпочтительно 0,01-10 г.

При обработке почвы в месте применения активного вещества требуются концентрации от 0,00001 до 0,1 вес.%, предпочтительно 0,0001 до 0,02 вес.%.

Изобретение иллюстрируется следующими примерами.

Пример 1

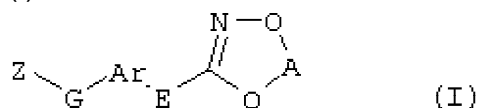


К 1,8 г (25 ммоль) гидрохлорида гидроксилamina в 20 мл метанола при 20°C медленно добавляют раствор 3,3 г 86%-ной гидроокиси калия в 20 мл метанола. Затем порциями добавляют 4,0 г (12,8 ммоль) сложного метилового эфира α-метоксимино-α-[2-(2-метил-фенокси-метил)-фенил]-уксусной кислоты, после чего реакционную смесь перемешивают при 40°C до окончания реакции, определяемого путем тонкослойной хроматографии. После этого к реакционной смеси добавляют сначала 1,7 г (12,8 ммоль) карбоната калия, а затем 10,8 г (59 ммоль) 1,2-дибром-этана. Смесь в течение 12 часов перемешивают при 65 °C, затем охлаждают до 20°C и фильтруют. Фильтрат сгущают в получаемом с помощью водоструйного насоса вакууме, а остаток очищают путем хроматографии на колонке, содержащей силикагель (элюент: толуол и ацетон в объемном соотношении 9:1).

Получают 1,4 г (33% теории) 3-{α-метоксимино-α-[2-(2-метил-фенокси-метил)-фенил]-метил}-5,6-дигидро-1,4,3-диоксазина. Показатель преломления $n_D^{20}=1,5705$.

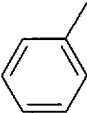
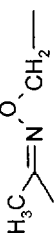
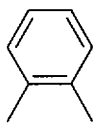
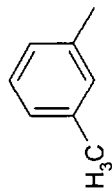
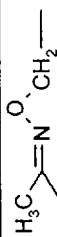
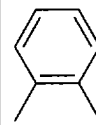
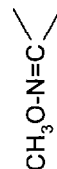
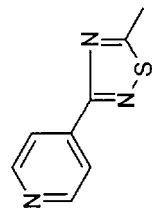
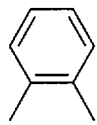
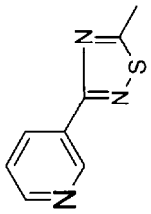
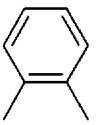
Целевой продукт данного примера также получают при замене 1,2-дибром-этана на 1,2-диметилсульфонилоксиэтан и 1,2-дифенилсульфонилокси-этан.

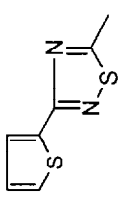
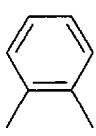
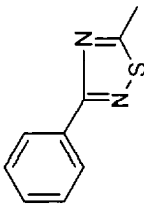
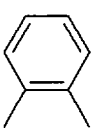
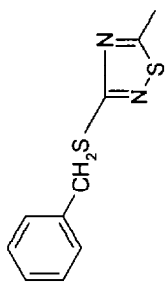
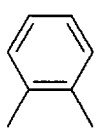
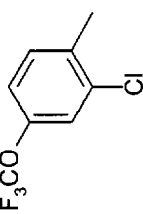
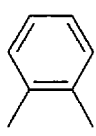
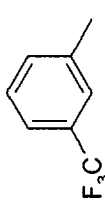
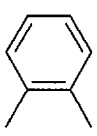
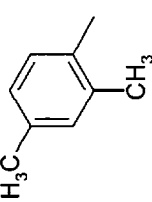
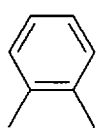
Аналогично примеру 1, а также в соответствии с общим описанием предлагаемого способа можно также получать приведенные в следующей таблице 1 соединения формулы (I).

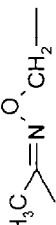
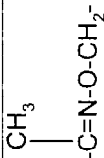


^1H -ЯМР-спектры поглощены в CDCl_3 с тетраметилсиланом в качестве внутреннего стандарта. Химические смещения, как правило, приводятся значениями δ (см. табл.1).

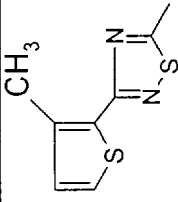
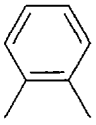
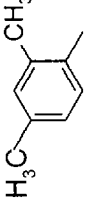
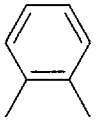
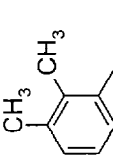
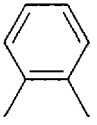
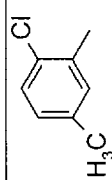
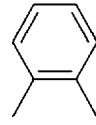
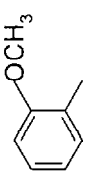
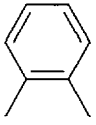
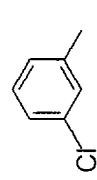
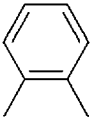
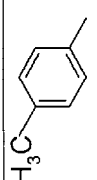
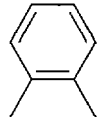
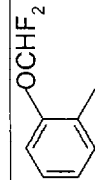
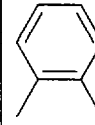
Таблица 1: примеры соединений формулы (I)

Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
2					CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: 2,25; 3,95; 4,05-4,51; 5,15; 7,0-7,68 м.д.
3					CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: 2,23; 2,25; 3,98; 4,1-4,52; 7,05-7,55 м.д.
4		O			CH ₂ CH ₂	Т.пл. 138°C
5		O			CH ₂ CH ₂	Т.пл. 65°C

Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
6		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	(аморфно) ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,75$ (с.3H)
7		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	Т.пл. 70°C
8		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	масло ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,80$ (с.3H)
9		$-\text{OCH}_2-$		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	$\log P^*/4,03$
10		$-\text{OCH}_2-$		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: 1,55; 3,97; 4,16; 4,48; 5,03; 7,08-7,51 м.д.
11		$-\text{OCH}_2-$		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	Т.пл. 129°C

Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
12		-OCH ₂ -			CH ₂ CH ₂	аморфно ¹ H-ЯМР: 2,24; 2,28; 3,99; 4,15; 4,46; 4,98; 6,62-7,59 м.д.
13		-OCH ₂ -			CH ₂ CH ₂	Т.пл. 123 ⁰ С
14		-OCH ₂ -			CH ₂ CH ₂	Т.пл. 98-105 ⁰ С
15					CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: (CDCl ₃ , δ): 2,26 (3H); 3,96 (3H); 4,1-4,2 (2H); 4,4-4,5 (2H); 5,204 (2H); 7,0-8,0 (8H) м.д.
16		-OCH ₂ -			CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: (CDCl ₃ , δ): 2,30 (3H); 3,98 (3H); 4,1-4,2 (2H); 4,4-4,5 (2H); 4,97 (2H); 6,4-7,4 (7H) м.д.
17					CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: (CDCl ₃ , δ): 2,25 (3H); 4,0 (3H); 4,1-4,2 (2H); 4,4-4,5 (2H); 5,176 (2H); 7,114-7,131 (1H); 7,44-7,45 (1H); 7,4-8,0 (4H) м.д.

Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
18		-CH ₂ O-		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	масло
19		-O-		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	(аморфно) ¹ H-ЯМР: (CDCl ₃), δ = 3,80 (с,3H)
20		-CH ₂ O		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	Т.пл. 142 ⁰ С
21		-CH ₂ O		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	масло δ = 3,95 (с,3H)
22		-O-		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	Т.пл. 106 ⁰ С
23		-O-		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	Т.пл. 82 ⁰ С

Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
24		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	масло ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,80$ (с,3H)
25		$-\text{CH}_2\text{O}-$		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	Т.пл. 123°C
26		$-\text{OCH}_2-$		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	Т.пл. 75°C
27		$-\text{OCH}_2-$		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	Т.пл. 119°C
28		$-\text{OCH}_2-$		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	Т.пл. 83°C
29		$-\text{OCH}_2-$		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	(аморфно) ^1H -ЯМР: 3,98; 4,15; 4,47; 4,98; 6,80; 7,55 м.д.
30		$-\text{OCH}_2-$		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	(аморфно) ^1H -ЯМР: 2,27; 3,97; 4,14; 4,47; 4,96; 6,18- 7,53 м.д.
31		$-\text{OCH}_2-$		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	(аморфно) ^1H -ЯМР: 3,95; 4,15; 4,48; 5,07; 6,92-7,54 м.д.

5

10

15

20

25

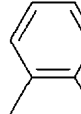
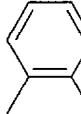
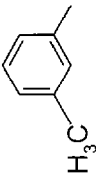
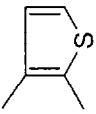
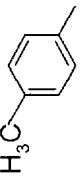
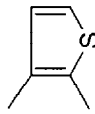
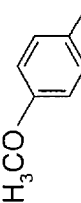
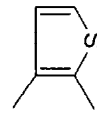
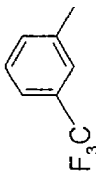
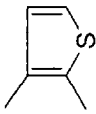
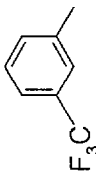
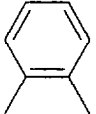
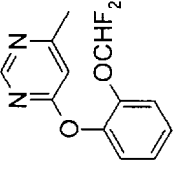
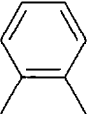
30

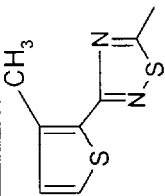
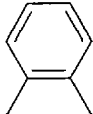
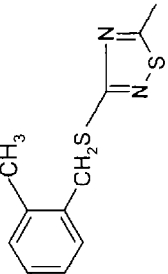
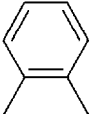
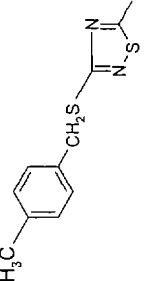
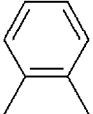
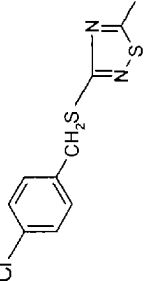
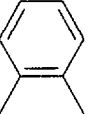
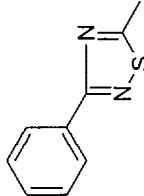
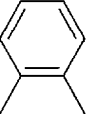
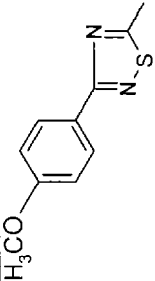
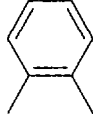
35

40

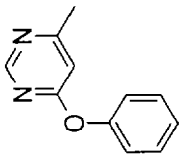
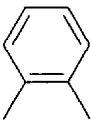
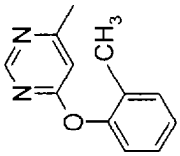
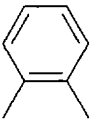
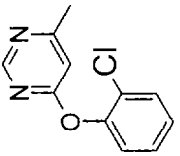
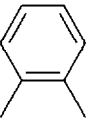
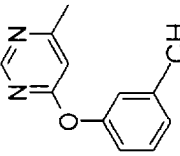
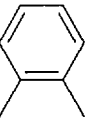
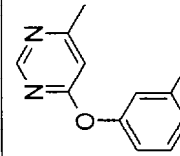
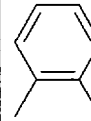
45

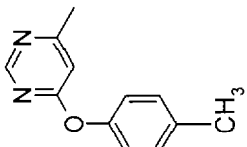
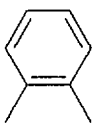
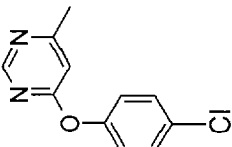
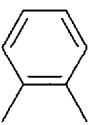
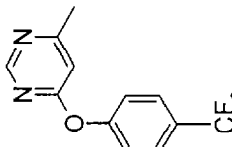
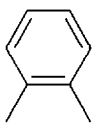
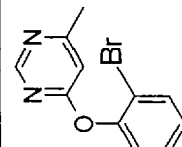
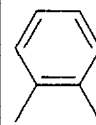
50

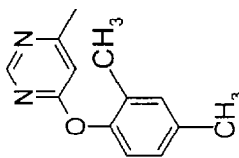
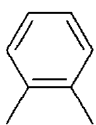
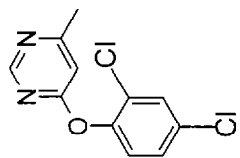
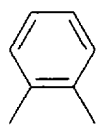
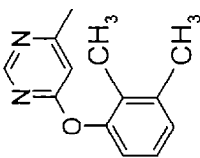
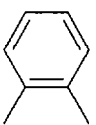
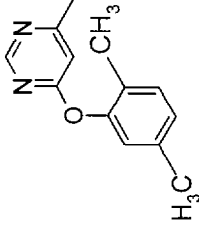
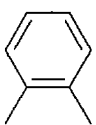
Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
32		-OCH ₂ -		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	Т.пл. 131°C
33		-O-		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	Т.пл. 95°C
34		-O-		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	масло
35		-O-		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	Т.пл. 119°C
36		-O-		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	масло
37		-O-		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	масло
38		-O-		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	(аморфно)
39		-O-		CH ₃ O-N=C<	CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: (CDCl ₃) δ = 3,80 (с,3H)

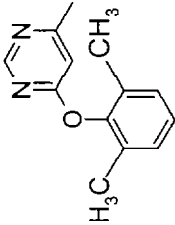
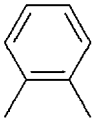
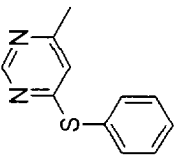
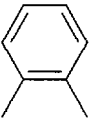
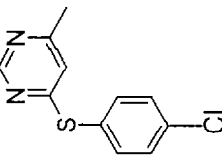
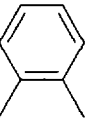
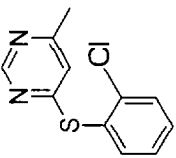
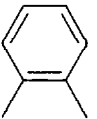
Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
40		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	$\log P: 3,5$
41		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	масло ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,80$ (с, 3H)
42		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	Т.пл. 128°C
43		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	масло ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,80$ (с, 3H)
44		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	Т.пл. 70°C
45		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	Т.пл. $70-73^\circ\text{C}$

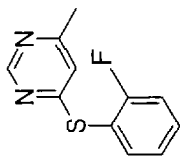
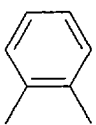
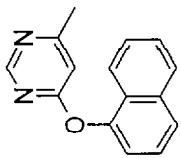
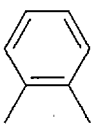
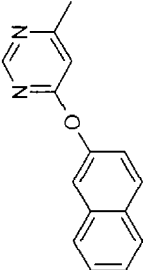
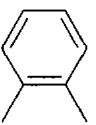
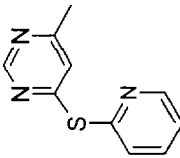
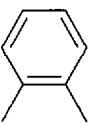
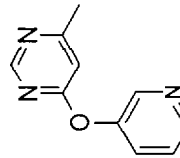
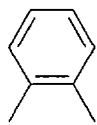
Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
46		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,85$ (с, 3H)
47		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH_2CH_2	масло $\delta = 3,85$ (с, 3H)
48		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH_2CH_2	Т.пл. 132°C
49		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH_2CH_2	$\log P : 3,4$
50		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH_2CH_2	$\log P : 3,6$

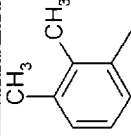
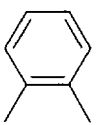
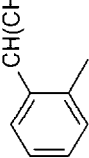
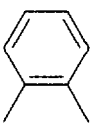
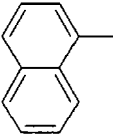
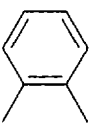
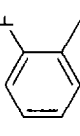
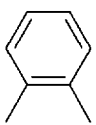
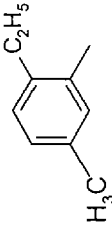
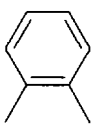
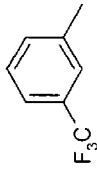
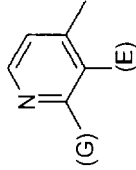
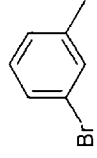
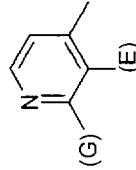
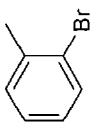
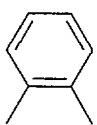
Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
51		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	масло ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,80$ (с, 3H)
52		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	масло $\delta = 3,80$ (с, 3H)
53		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,80$ (с, 3H)
54		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно $\delta = 3,80$ (с, 3H)
55		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,80$ (с, 3H)

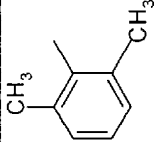
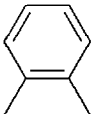
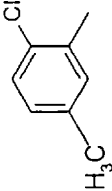
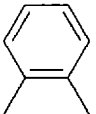
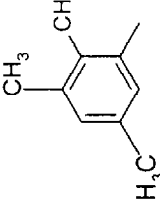
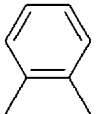
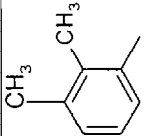
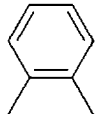
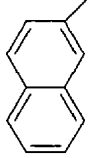
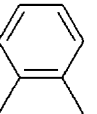
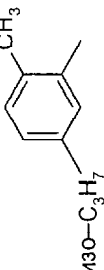
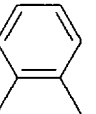
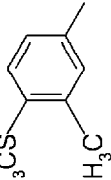
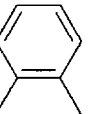
Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
56		-O-		$\text{CH}_3\text{O}\cdot\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,80$ (с,3H)
57		-O-		$\text{CH}_3\text{O}\cdot\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,80$ (с,3H)
58		-O-		$\text{CH}_3\text{O}\cdot\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,80$ (с,3H)
59		-O-		$\text{CH}_3\text{O}\cdot\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,80$ (с,3H)

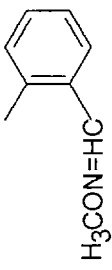
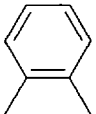
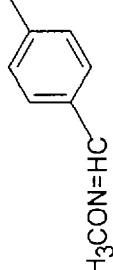
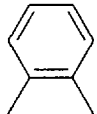
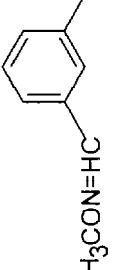
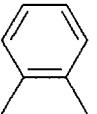
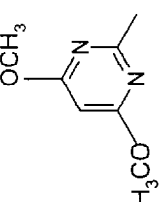
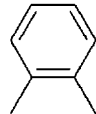
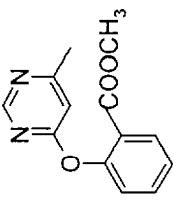
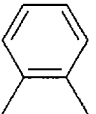
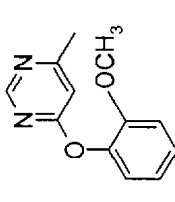
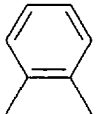
Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
60		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,80$ (с,3H)
61		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно $\delta = 3,80$ (с,3H)
62		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	масло ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,80$ (с,3H)
63		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно $\delta = 3,80$ (с,3H)

Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
64		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: (CDCl_3) δ) = 3,80 (с,3H)
65		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: (CDCl_3) δ = 3,80 (с,3H)
66		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно δ = 3,80 (с,3H)
67		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: (CDCl_3) δ = 3,80 (с,3H)

Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
68		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH_2CH_2	$\log P: 3,1$
69		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH_2CH_2	аморфно $\log P: 3,3$
70		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH_2CH_2	$\log P: 3,2$
71		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,85$ (с, 3H)
72		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH_2CH_2	аморфно ^1H -ЯМР: (CDCl_3) $\delta = 3,85$ (с, 3H)

Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
73		-CH ₂ O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	Т.пл. 146°C
74		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	(аморфно) ¹ H-ЯМР: 1,23; 1,26; 3,39-3,46; 4,0; 4,15; 4,48; 5,0; 6,8-7,6 м.д.
75		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	Т.пл. 115°C
76		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	Т.пл. 103°C
77		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	Т.пл. 62°C
78		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	Т.пл. 118°C
79		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	аморфно
80		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: 3,98; 4,16; 4,49; 5,09; 6,82-7,56 м.д.

Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
81		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: 2,29; 3,95; 4,15; 4,47; 4,71; 6,92-7,82 м.д.
82		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: 2,26; 3,99; 4,19; 4,5; 5,06; 6,67-7,62 м.д.
83		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: 2,17-2,29; 3,98; 4,14; 4,48; 4,96; 6,5-7,6 м.д.
84		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: 2,20; 2,28; 3,97; 4,15; 4,46; 4,98; 6,68-7,58 м.д.
85		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	log P: 3,54
86		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: 1,19; 1,21; 2,25; 2,82; 3,98; 4,15; 4,45; 5,0; 6,66-7,58 м.д.
87		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: 2,34; 2,38; 3,98; 4,15; 4,47; 4,97; 6,73-7,52 м.д.

Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
88	 $\text{H}_3\text{CON}=\text{HC}$	-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH ₂ CH ₂	аморфно ¹ H-ЯМР: 3,97; 4,13; 4,45; 5,03; 6,86-8,50 м.д.
89	 $\text{H}_3\text{CON}=\text{HC}$	-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: 3,94; 3,97; 4,15; 4,47; 5,02; 6,90-8,0 м.д.
90	 $\text{H}_3\text{CON}=\text{HC}$	-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH ₂ CH ₂	¹ H-ЯМР: 3,98; 4,15; 4,47; 5,01; 6,92-8,02 м.д.
91	 H_3CO	O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH ₂ CH ₂	Т.пл. 133°C
92	 COOCH_3	O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH ₂ CH ₂	аморфно ¹ H-ЯМР: (CDCl ₃) δ = 3,15 (с,3H)
93	 OCH_3	O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	CH ₂ CH ₂	аморфно δ = 3,80 (с,3H)

5

10

15

20

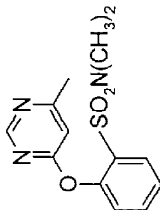
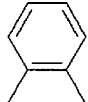
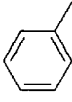
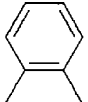
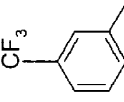
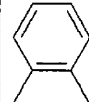
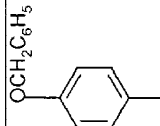
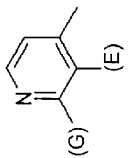
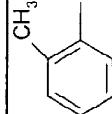
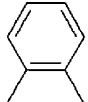
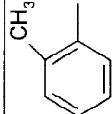
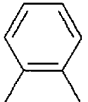
25

30

35

40

45

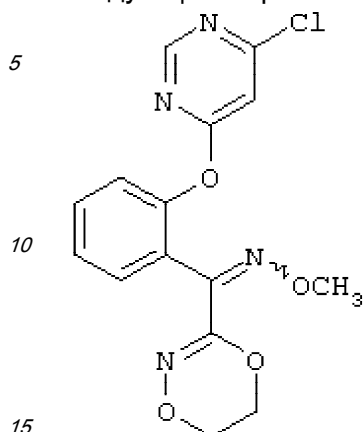
Пример №.	Z	G	Ar	E	A	физические данные
94		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	T. пл. >200°C
95		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	аморфно ¹ H-ЯМР: 3,97; 4,14; 4,46; 5,0; 6,91-7,54 м.д.
96		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	аморфно ¹ H-ЯМР: 3,97; 4,14; 4,48; 5,03; 7,08-7,51 м.д.
97		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2CH_2	аморфно
98		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	CH_2	¹ H-ЯМР: 2,25; 4,0; 5,0; 5,86; 6,75-7,6 м.д.
99		-OCH ₂ -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$	¹ H-ЯМР: 1,4; 2,3; 3,6-4,5; 5,0; 6,8-7,6 м.д.

50

*Значение log P определено согласно EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 путем высокопроизводительной жидкостной хроматографии на обратнофазной колонке (С 18) при температуре 43°C с применением в качестве элюента 0,1%-ной водной фосфорной кислоты и линейного градиента ацетонитрила (от 10% до 90%). Калибровка осуществлялась линейными алкан-2-онами, значение log P которых известны (определение значений log P на основе времени удерживания путем линейной интерполяции между

двумя последующими алканонами).

Приведенное в таблице 1 в качестве примера 22 соединение можно получать, например, следующим образом:

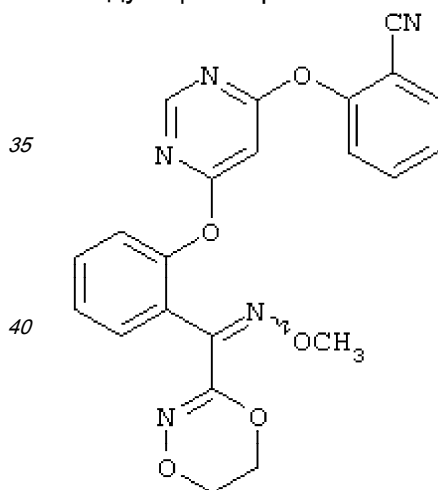


К смеси 1,5 г (6 ммоль) 3-[α-метоксимино-α-(2-гидрокси-фенил)-метил]-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина, 0,9 г (6 ммоль) 4,6-дихлор-пиримидина и 30 мл N,N-диметилформаида добавляют на ледяной бане 0,3 г (6 ммоль) 60%-ной суспензии гидроида натрия в беленом масле. После удаления ледяной бани реакционную смесь в течение 15 часов перемешивают при 20°C. После этого сгущают в вакууме, создаваемом при помощи масляного насоса, остаток подают в сложный этиловый эфир уксусной кислоты, промывают водой, сушат над сульфатом натрия и фильтруют. Из фильтрата растворитель тщательно отгоняют в вакууме, получаемом с помощью водоструйного насоса.

Получают 1,9 г (86% теории) 3-{α-метоксимино-α-[2-(6-хлор-пиримидин-4-ил-окси)-фенил]-метил}-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина в качестве маслянистого остатка.

Целевой продукт данного примера можно также получать при замене 4,6-дихлор-пиримидина на 4-хлор-6-метилсульфонилокси-пиримидин или 4-хлор-6-фенилсульфонилокси-пиримидин.

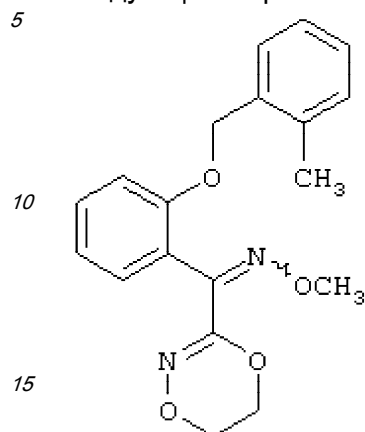
Приведенное в таблице 1 в качестве примера 23 соединение можно получать, например, следующим образом:



Смесь 0,3 г (0,9 ммоль) 3-[α-метоксимино-α-[2-(6-хлор-пиримидин-4-ил-окси)-фенил]-метил]-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина, 0,1 г (0,9 ммоль) 2-гидроксибензонитрила, 0,1 г (0,9 ммоль) карбоната калия, хлорид меди (I) с конца шпателя и 5 мл N,N-диметилформаида перемешивают в течение 15 часов при 100°C. После этого сгущают в вакууме, создаваемом при помощи масляного насоса, остаток подают в сложный этиловый эфир уксусной кислоты, промывают водой, сушат над сульфатом натрия и фильтруют. Фильтрат сгущают, а остаток очищают путем хроматографии на колонке, содержащей силикагель (элюент: гексан и ацетон в объемном соотношении 7:3).

Получают 0,3 г (81% теории) 3-{ α -метоксимино- α -[2-(6-(2-циано-фенокси)-пиримидин-4-ил-окси)-фенил]-метил}-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина с точкой плавления 82°C.

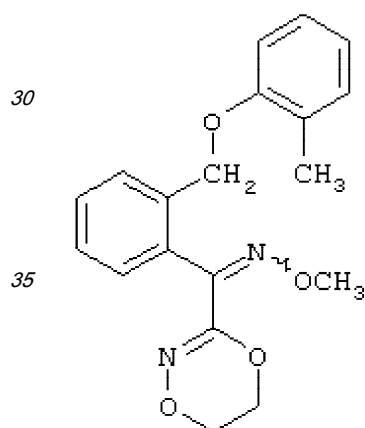
Приведенное в таблице 1 в качестве примера 20 соединение можно получать, например, следующим образом:



Смесь 0,5 г (2 ммоль) 3-[(α -метоксимино- α -(2-гидрокси-фенил)-метил]-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина, 0,3 г (2,2 ммоль) 2-метилбензилхлорида, 0,4 г (2,5 ммоль) карбоната калия и 10 мл ацетонитрила нагревают с обратным холодильником в течение 15 часов. Затем сгущают, остаток подают в хлористый метилен, промывают водой, сушат над сульфатом натрия и фильтруют. Из фильтрата растворитель тщательно отгоняют в вакууме, получаемом с помощью водоструйного насоса.

Получают 0,4 г (59% теории) 3-{ α -метоксимино- α -[2-(2-метил-бензилокси)-фенил]-метил}-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина с точкой плавления 142°C.

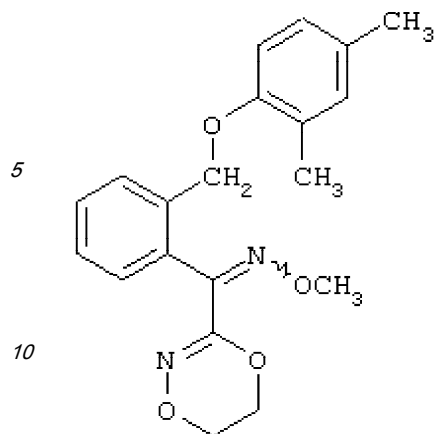
Получаемое согласно примеру 1 соединение можно также получать, например, следующим образом:



0,75 г (2,4 ммоль) 3-[(α -метоксимино- α -(2-бромметил-фенил)-метил]-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина и 0,70 г (6,4 ммоль) 2-метилфенола растворяют в 15 мл диметилформамида, после охлаждения смеси до -10°C медленно добавляют 0,21 г (7,0 ммоль) 80%-ного гидроксида натрия. После удаления охлаждающей ванны реакционную смесь в течение 14 часов перемешивают при температуре не более 25°C, после чего ее наливают на воду, взятую прибл. в двукратном объемном количестве. После встряхивания в смеси со сложным этиловым эфиром уксусной кислоты органическую фазу отделяют, промывают 2-н. натровым щелочом, сушат над сульфатом натрия и фильтруют. Из фильтрата растворитель тщательно отгоняют при пониженном давлении.

Получают 0,40 г (49% теории) 3-{ α -метоксимино- α -[2-(2-метил-фенокси-метил)-фенил]-метил}-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина (показатель преломления: $n_D^{20}=1,5705$).

Приведенное в таблице 1 в качестве примера 11 соединение можно получать, например, следующим образом:



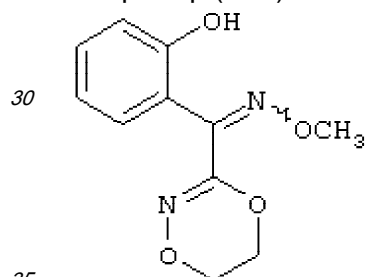
0,20 г (0,56 ммоль) N-(2-гидрокси-этоксид)- α -метоксимино- α -[2-(2,4-диметил-фенокси-метил)-фенил]-ацетамида растворяют в 3 мл хлороформа и смешивают при 0°C с 0,25 г (1,76 ммоль) фосфорного ангидрида. Реакционную смесь перемешивают сначала в течение часа при 20°C, и затем в течение 4 часов при кипячении, после чего ее наливают на воду, взятую прибл. в двукратном объемном количестве, и встряхивают. После отделения органической фазы водную фазу три раза дополнительно экстрагируют хлороформом. Объединенные органические экстракты сушат над сульфатом магния, после чего их сгущают и очищают путем хроматографии на колонке, содержащей силикагель (элюент: толуол и ацетон в соотношении 10:1).

Получают 84 мг (42% теории) 3-{ α -метоксимино- α -[2-(2,4-диметил-фенокси-метил)-фенил]-метил}-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина.

¹H-ЯМР (D₆-ДМСО, δ): 4,87; 3,84; 4,38; 4,10 м.д.

Получение исходных веществ формулы (IV):

Пример (IV-1)

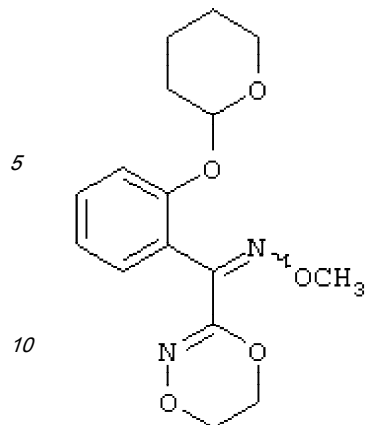


9,0 г (28 ммоль) 3-[(α -метоксимино- α -[2-тетрагидропиран-2-ил-окси)-бензил]-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина и 1,8 г ионообменника "Lewatit SPC 108" в 90 мл метанола перемешивают в течение 15 часов при 20°C. После этого смесь сгущают в вакууме, получаемом с помощью водоструйного насоса, остаток подают в хлористый метилен и фильтруют. Фильтрат сгущают в вакууме, получаемом с помощью водоструйного насоса, а остаток очищают путем хроматографии на колонке, содержащей силикагель (элюент: гексан и ацетон в объемном соотношении 7:3).

В качестве 1-й фракции получают 0,6 г (9% теории) 7-{3-[α -метоксимино- α -(2-гидрокси-фенил)-метил]-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина} в виде аморфного продукта, а в качестве 2-й фракции - 3,3 г (50% теории) Е-{3-[α -метоксимино- α -(2-гидрокси-фенил)-метил]-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина} с точкой плавления 153°C.

Получение исходных веществ формулы (IX):

Пример (IX-1)

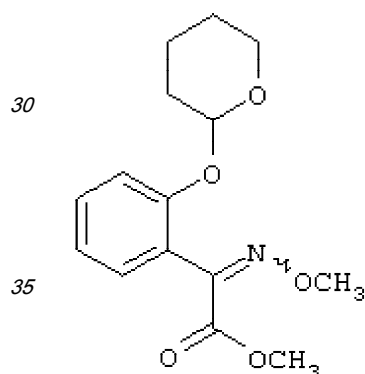


К 6,8 г (98 ммоль) гидрохлорида гидроксилamina в 290 мл метанола добавляют 13,9 г (211 ммоль) 85%-ного водного раствора гидроокиси калия и 17 г (58 ммоль) сложного метилового эфира α -метоксимино- α -(2-тетра-гидропиран-2-ил-окси-фенил)-уксусной кислоты, после чего смесь перемешивают в течение часа при 40°C. Затем прибавляют 7,7 г (56 ммоль) карбоната калия и каплями добавляют 42,5 г (226 ммоль) 1,2-дибромэтана. Смесь в течение 15 часов нагревают с обратным холодильником, а затем сгущают в вакууме, получаемом с помощью водоструйного насоса. Остаток подают в хлористый метилен, промывают водой, сушат над сульфатом натрия и фильтруют. Фильтрат сгущают, а остаток очищают путем хроматографии на колонке, содержащей силикагель (элюент: гексан и ацетон в объемном соотношении 7:3).

Получают 9,0 г (49% теории) 3-[α -метоксимино- α -(2-тетрагидропиран-2-ил-окси)-бензил]-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина в качестве маслянистого продукта.

Получение исходных веществ Формулы (X):

Пример (X-1)

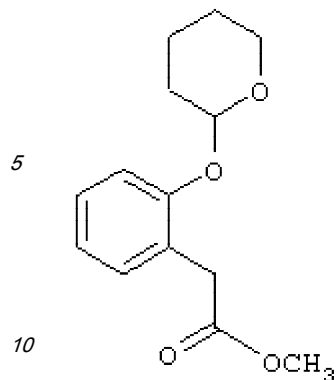


К раствору 203 г (1,81 моль) трет. бутилата калия в 2 л трет. бутанола добавляют каплями 564 г (4,93 моль) трет. бутилнитрита и 411 г (1,64 моль) сложного метилового эфира 2-тетрагидропиранилокси-фенилуксусной кислоты, растворенных в 500 мл трет. бутанола. По истечении 90 минут добавляют каплями 350 г (2,47 моль) метилйодида, после чего смесь перемешивают в течение 15 часов при 20°C. Затем в вакууме, получаемом с помощью водоструйного насоса, остаток подают в простой метил-трет.-бутиловый эфир, сушат над сульфатом натрия и фильтруют. Остаток кристаллизуют путем дигерирования с помощью диэтилового эфира, и продукт выделяют путем отсасывания.

Получают 69,3 г (15% теории) сложного метилового эфира α -метоксимино- α -(2-тетрагидропиран-2-ил-окси-фенил)-уксусной кислоты с точкой плавления 79°C.

Получение исходных веществ формулы (XI):

Пример (XI-1)



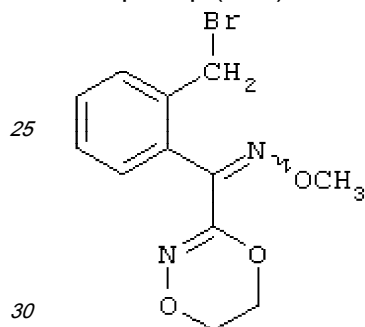
Смесь 500 г (3,0 моль) сложного метилового эфира 2-гидрокси-фенил-уксусной кислоты, 506 г (6,0 моль) 3,4-дигидро-пирана, п-толуолсульфокислоту с конца шпателя и 2,5 л тетрагидрофурана перемешивают в течение 15 часов при 20°C, затем ее при

15 перемешивании смешивают с 10%-ным ледяным водным раствором гидроокиси калия, после чего добавляют сульфат натрия и фильтруют. Из фильтрата растворитель тщательно отгоняют в вакууме, получаемом с помощью водоструйного насоса.

Получают 698 г (99% теории) сложного метилового эфира 2-тетрагидропиранил-окси-фенилуксусной кислоты в качестве маслянистого остатка.

20 Получение исходных веществ формулы (VI):

Пример (VI-1)



0,50 г (2,13 ммоль) 3-[α-метоксимино-α-[2-метил-фенил)-метил]-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина и 0,57 г (3,2 ммоль) N-бром-сукцинимиды подают в 10 мл тетра-хлорметана и после добавления 200 мг азоизобутиронитрила нагревают с обратным холодильником в течение 4 часов. После добавления дальнейших 0,57 г (3,2 ммоль) N-бром-сукцинимиды, смесь в течение дальнейшего часа нагревают с обратным холодильником. После этого ее охлаждают и фильтруют, фильтрат сгущают, а осадок подвергают хроматографии на силикагеле (элюент: толуол и ацетон в соотношении 10:1).

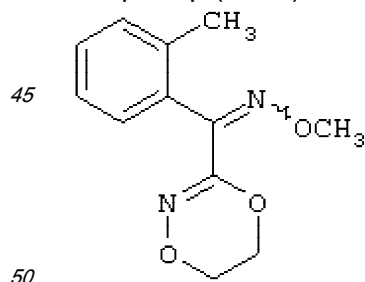
35

Получают 20 мг (30% теории) 3-[α-метоксимино-α-[2-бромметил-фенил)-метил]-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина. ¹H-ЯМР (CDCl₃, δ): 4,4 м.д.

40

Получение исходных веществ формулы (XIII):

Пример (XIII-1)



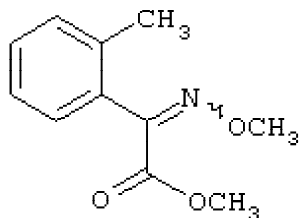
К 19,6 г (0,283 моль) гидрохлорида гидроксиламина в 150 мл метанола добавляют медленно раствор 36,9 г (0,565 моль) 86%-ного гидроокиси калия в 150 мл метанола. Затем добавляют порциями 30 г (0,145 моль) сложного метилового

эфира α -метоксимино- α -(2-метил-фенил)-уксусной кислоты. Смесь перемешивают в течение 3 часов при 50°C. После этого при 20°C добавляют 20 г (0,145 моль) карбоната калия и 122 г (0,65 моль) 1,2-дибромэтана. Реакционную смесь перемешивают в течение 17 часов при 65°C. После охлаждения отсасывают, фильтрат сгущают, а осадок подвергают

хроматографии на силикагеле (элюент: толуол и ацетон в соотношении 15:1).
Получают 15,2 г (45% теории) 3-[α -метоксимино- α -(2-метил-фенил)-метил]-5,6-дигидро-1,4,2-диоксазина. ^1H -ЯМР (CDCl_3 , δ): 2,2 м.д.

Получение исходных веществ формулы (XIV):

Пример (XIV-1)



187,5 г (1,673 моль) трет. бутилата калия растворяют в 1875 мл трет. бутанола. К этому раствору добавляют раствор 471,5 г (4,57 моль) трет. бутилнитрита и 250 г (1,525 моль) сложного метилового эфира 2-метил-фенилуксусной кислоты в 500 мл трет. бутанола таким образом, что внутренняя температура не превышает 50°C. Смесь перемешивают в течение 90 минут при 20 - 30°C. После этого добавляют каплями 326,5 г (2,3 моль) метилйодида. Реакционную смесь перемешивают в течение 14 часов при 20°C. Затем растворитель отгоняют в вакууме, получаемом с помощью водоструйного насоса, остаток подают в 2 л воды и три раза экстрагируют сложным этиловым эфиром уксусной кислоты. Объединенные органические фазы сушат над сульфатом натрия и фильтруют. Фильтрат сгущают, осадок подают в 250 мл изопропанола и при кипячении смешивают с водой до помутнения.

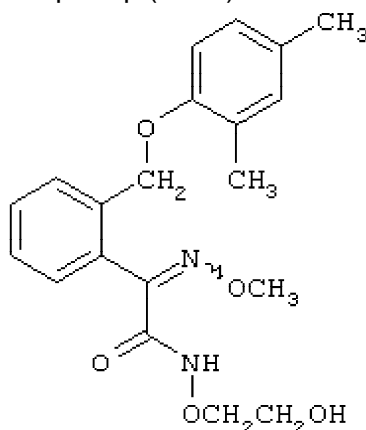
После охлаждения до 0°C и перемешивания в течение 60 минут, выкристаллизовавшийся продукт выделяют путем отсасывания.

Получают 84,5 г (27% теории) сложного метилового эфира α -метоксимино- α -(2-метил-фенил)-уксусной кислоты с точкой плавления 53°C.

^1H -ЯМР (CDCl_3 , δ): 2,19 м.д.

Получение исходных веществ формулы (VIII):

Пример (VIII-1)



0,8 г (2,36 ммоль) хлорангидрида α -метоксимино- α -[2-(2,4-диметил-фенокси-метил)-фенил]-уксусной кислоты растворяют в 10 мл тетрагидрофурана. К этому раствору добавляют 0,26 г (2,6 ммоль) триэтиламина. Затем при 0°C добавляют каплями 0,25 г (2,6 ммоль) О-(2-гидрокси-этил)-гидроксиламина, растворенного в 10 мл тетрагидрофурана. Реакционную смесь в течение 2 часов перемешивают при 20°C. После этого ее наливают на воду и экстрагируют сложным этиловым эфиром уксусной кислоты. Экстракционный

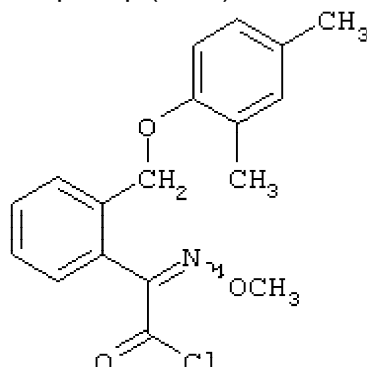
раствор сушат над сульфатом магния, сгущают и подвергают хроматографии на силикагеле (элюент: толуол и ацетон в соотношении 10:1).

Получают 0,4 г (50% теории) N-(2-гидрокси-этокси)- α -метоксимино- α -[2-(2,4-диметил-фенокси-метил)-фенил]-ацетамида.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ): 3,65; 3,90; 9,15 м.д.

Получение исходных веществ формулы (XV):

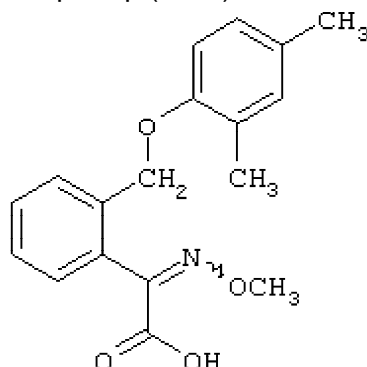
Пример (XV-1)



0,93 г (2,95 ммоль) α -метоксимино- α -[2-(2,4-диметил-фенокси-метил)-фенил]-уксусной кислоты смешивают с 4,0 г (2,9 ммоль) тионилхлорида и 50 мг диметилформаида, и получаемую смесь в течение 30 минут перемешивают с обратным холодильником. После этого легколетучие компоненты тщательно отгоняют при пониженном давлении.

Получают 0,95 г хлорангидрида α -метоксимино- α -[2-(2,4-диметил-фенокси-метил)-фенил]-уксусной кислоты в качестве маслянистого остатка.

Пример (XV-2)



2,0 г (6,1 ммоль) сложного метилового эфира α -метоксимино- α -[2-(2,4-диметил-фенокси-метил)-фенил]-уксусной кислоты растворяют в 20 мл изопропанола. К этому раствору добавляют 30 мл 1 н. натрового щелока. Затем смесь в течение 14 часов перемешивают при 40°C, после чего ее наливают на воду. Затем 2-н. натровым щелоком значение pH доводят до 6, и выкристаллизовавшийся продукт выделяют путем отсасывания.

Получают 1,5 г (78% теории) α -метоксимино- α -[2-(2,4-диметил-фенокси-метил)-фенил]-уксусной кислоты.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ): 3,9; 4,85 м.д.

Фунгицидная активность замещенных азиадиксоциклоалкенов формулы (I) подтверждается следующими примерами.

Пример А

Опыт с *Pyrenophora teres* (ячмень)/защитное действие

1 вес. часть активного вещества смешивают с 10 вес. частями N-метилпирролидона в качестве растворителя и 0,6 вес. части простого алкиларилполигликолевого эфира в качестве эмульгатора и полученный концентрат разбавляют водой до желаемой концентрации.

Для исследования защитного действия молодые растения опрыскивают препаратом активного вещества до образования капель. После присыхания препарата растения опрыскивают конидиальной суспензией *Pyrenophora teres*. Затем растения в течение 48 часов хранят в инкубационной камере при температуре 20°C и относительной влажности воздуха 100%.

После этого растения хранят в теплице при температуре около 20°C и относительной влажности воздуха около 80%.

Через 7 дней после инокуляции проводят оценку.

При этом устанавливают, что степень активности соединения примера 1 составляет 100% при норме расхода 400 г/га.

Такую же активность проявляют соединения примеров 6, 8, 19, 23, 24, 39, 44, 46, 47, 52, 53, 65, 69, 72, 78, 79.

Если применять соединения примеров 2, 15, 16, 26 и 29 при норме расхода 250 г/га, то степень активности составляет соответственно 83, 67, 67, 72 и 68% от необработанных контрольных растений.

Пример Б

Опыт с *Phytophthora* (помидоры)/системное действие

1 вес. часть соединения примера 1 в качестве активного вещества смешивают с 4,7 вес. части ацетона в качестве растворителя и 0,6 вес. части простого алкиларилполигликолевого эфира в качестве эмульгатора и полученный концентрат разбавляют водой до желаемой концентрации.

Для исследования системных свойств препарат активного вещества наливают на почву, в которой находятся готовые к проведению опыта молодые растения. Через 3 дня после обработки растения инокулируют водной суспензией спор *Phytophthora infestans*.

Затем растения хранят в инкубационной камере при температуре около 20°C и относительной влажности воздуха 100%.

Через 3 дня после инокуляции проводят оценку.

При этом устанавливают, что степень активности соединения примера 1 составляет 58% при концентрации 100 ч/млн.

Пример В

Опыт с *Pyricularia* (рис) / системное действие.

1 вес. часть соединения примера 1 в качестве активного вещества смешивают с 12,5 вес. части ацетона в качестве растворителя и 0,3 вес. части простого алкиларилполигликолевого эфира в качестве эмульгатора и полученный концентрат разбавляют водой до желаемой концентрации.

Для исследования системных свойств 40 мл препарата активного вещества наливают на почву, в которой выросли молодые рисовые растения. Через 7 дней после обработки растения инокулируют водной суспензией спор *Pyricularia oryzae*. После этого растения до проведения оценки хранят в теплице при температуре 25°C и относительной влажности воздуха 100%.

Через 4 дня после инокуляции проводят оценку поражения.

При этом устанавливают, что степень активности соединения примера 1 составляет 80% при расходе 100 мг/100 мл.

Пример Г

Опыт с *Venturia* (яблоня)/защитный

1 вес. часть активного вещества смешивают с 4,7 вес. части ацетона в качестве растворителя и 0,3 вес. части алкиларилполигликолевого простого эфира в качестве эмульгатора и полученный концентрат разбавляют водой до концентрации, равной 2,5 ч/млн.

Для проверки на защитную активность молодые растения обрызгивают композицией биологически активного вещества. После высыхания нанесенного состава растения инокулируют водной суспензией конидий возбудителя яблочной парши *Venturia inaequalis* и затем оставляют на один день в инкубационной камере при температуре 20°C и 100%-

ной относительной влажности воздуха.

Затем растения помещают в теплицу при температуре 20°C и относительной влажности воздуха около 70%.

Через двенадцать дней после инокуляции определяют процентную степень активности по сравнению с необработанными контрольными растениями. Результаты опыта сведены в таблице 2.

Таблица 2	
Активное вещество Примера №	Степень активности в % от необработанных контрольных растений
2	97
3	100
11	99
12	100
13	92
15	100
17	100
18	98
30	99
80	99
93	93

Пример Д

Опыт с *Sphaerotheca* (огурцы) / защитный

1 вес. часть активного вещества смешивают с 4,7 вес. частей ацетона в качестве растворителя и 0,3 вес. части алкиларилполигликолевого простого эфира в качестве эмульгатора и полученный концентрат разбавляют водой до концентрации, равной 10 ч/млн.

Для проверки на защитную активность молодые растения обрызгивают композицией биологически активного вещества. После высыхания нанесенного состава растения опыляют конидиями гриба *Sphaerotheca fuliginea*. Затем растения помещают в теплицу при температуре 23-24°C и относительной влажности воздуха около 75%.

Через десять дней после инокуляции определяют процентную степень активности по сравнению с необработанными контрольными растениями. Результаты опыта сведены в таблице 3.

Таблица 3	
Активное вещество примера №	Степень активности в % от необработанных контрольных растений
11	100
12	95
14	95
30	94
33	96
51	92
80	100
93	100

Пример Е Опыт с *Pseudocercospora herpotrichoides* (пшеница) / защитный

1 вес. часть активного вещества смешивают с 10 вес. частями М-метилпирролидона в качестве растворителя и 0,6 вес. части алкиларилполигликолевого простого эфира в качестве эмульгатора и полученный концентрат разбавляют водой.

Для проверки на защитную активность молодые растения обрызгивают композицией биологически активного вещества, при этом биологически активное вещество применяют в количестве, равном 250 г/га. После высыхания нанесенного состава растения инокулируют у основания стебля спорами *Pseudoercospora herpotrichoides*. Затем растения помещают в теплицу при температуре приблизительно 10°C и относительной влажности воздуха около 80%.

Через двадцать один день после инокуляции определяют процентную степень

активности по сравнению с необработанными контрольными растениями.

Результаты опыта сведены в таблице 4.

5

10

Таблица 4	
Активное вещество примера №	Степень активности в % от необработанных контрольных растений при норме расхода активного вещества, равной 250 г/га
5	75
11	100
12	90
15	90
24	100
38	90

Пример Ж

Опыт с *Cochliobolus sativus* (ячмень) / защитный

15

1 вес. часть активного вещества смешивают с 10 вес. частями N-метилпирролидона в качестве растворителя и 0,6 вес. части алкиларилполигликолевого простого эфира в качестве эмульгатора и полученный концентрат разбавляют водой.

Для проверки на защитную активность молодые растения обрызгивают композицией биологически активного вещества, при этом биологически активное вещество применяют в количестве, равном 250 г/га.

20

После высыхания нанесенного состава растения обрызгивают водной суспензией конидий *Cochliobolus sativus*.

Растения помещают в теплицу при температуре приблизительно 20°C и относительной влажности воздуха около 80%.

25

Через двадцать один день после инокуляции определяют процентную степень активности по сравнению с необработанными контрольными растениями при норме расхода, равной 250 г/га.

Результаты опыта сведены в таблице 5.

30

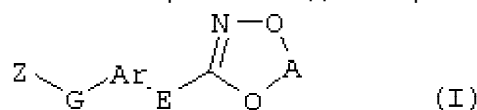
Таблица 5	
Активное вещество примера №	Степень активности в % от необработанных контрольных растений при норме расхода активного вещества, равной 250 г/га
11	70
16	62
26	81

35

Формула изобретения

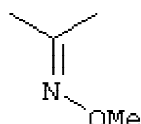
1. Замещенные азиноксоциклоалкены общей формулы (I)

40



где А - диметилен (этан-1,2-диил), незамещенный или замещенный метилом;
 Ar - орто-фенилен, незамещенный или замещенный фтором, тиофендиил или пиридиндиил;
 E - группа формулы

45



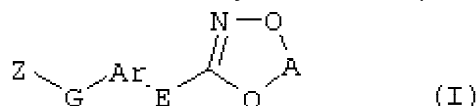
G - кислород, группы -O-CH₂-, -CH₂-O- или -C(CH₃)=N-O-CH₂-;

50

Z - фенил, пиримидинил или тиадиазолил, незамещенные или одно- или двукратно замещенные заместителями из группы, включающей метил, этил, n- или изопропил, n-, изо-, втор- или трет-бутил, метокси, этокси, трифторметил, трифторметокси, дифторметокси, фтор, хлор, бром, метилтио, этилтио, H₃C-O-N=CH-, бензилокси, нафтилокси, пиридинил, пиридинилтио, пиридинилокси, бензилтио, незамещенный или замещенный хлором или

метилом, тиенил, незамещенный или замещенный метилом, фенил, незамещенный или замещенный 1 или 2 одинаковыми или различными заместителями из группы, включающей метил, этил, метокси, этокси, дифторметилокси, трифторметил, фтор, хлор и бром, феноксигруппу, незамещенную или замещенную 1 или 2 одинаковыми или различными заместителями из группы, включающей фтор, хлор, бром, циано, метил, метокси, этил, дифторметилокси, трифторметил, метоксикарбонил и диметиламиносульфонил, и фенилтиогруппу, незамещенную или замещенную однократно фтором, хлором или бромом, или Z означает нафтил.

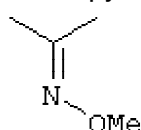
2. Способ получения замещенных азидадиоксоциклоалкенов общей формулы (I)



где A - диметилен (этан-1,2-диил), незамещенный или замещенный метилом;

Ar - ортофенилен, незамещенный или замещенный фтором, тиюфендиил или пиридиндиил;

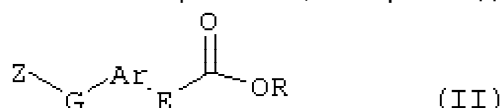
E - группа формулы



G - кислород, группы -O-CH₂-, -CH₂-O- или -C(CH₃)=N-O-CH₂-,

Z - фенил, пиримидинил или тиадизолил, незамещенные или одно- или двукратно замещенные заместителями из группы, включающей метил, этил, н- или изопропил, н-, изо-, втор- или трет-бутил, метокси, этокси, трифторметил, трифторметокси, дифторметокси, фтор, хлор, бром, метилтио, этилтио, H₃C-O-N=CH-, бензилокси, нафтилокси, пиридинил, пиридинилтио, пиридинилокси, бензилтио, незамещенный или замещенный хлором или метилом, тиенил, незамещенный или замещенный метилом, фенил, незамещенный или замещенный 1 или 2 одинаковыми или различными заместителями из группы, включающей метил, этил, метокси, этокси, дифторметилокси, трифторметил, фтор, хлор и бром, феноксигруппу, незамещенную или замещенную 1 или 2 одинаковыми или различными заместителями из группы, включающей фтор, хлор, бром, циано, метил, метокси, этил, дифторметилокси, трифторметил, метоксикарбонил и диметиламиносульфонил, и фенилтиогруппу, незамещенную или замещенную однократно фтором, хлором или бромом, или Z означает нафтил,

отличающийся тем, что производные карбоновой кислоты общей формулы (II)



где Ar, E, G и Z имеют вышеуказанные значения;

R представляет собой C₁-C₄-алкил,

подвергают взаимодействию с гидроксиламином или его галоидводородной солью при необходимости в присутствии акцептора кислоты и при необходимости в присутствии разбавителя, полученный продукт подвергают взаимодействию с двузамещенными алканами общей формулы (III)

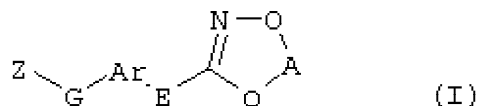


где A имеет вышеуказанное значение;

X - галоген, алкилсульфонилокси или фенилсульфонилокси,

при необходимости в присутствии акцептора кислоты и при необходимости в присутствии разбавителя с последующим выделением целевого продукта.

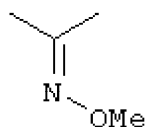
3. Способ получения замещенных азидадиоксоциклоалкенов общей формулы (I)



где A - диметилен (этан-1,2-диил);

Ar - орто-фенилен;

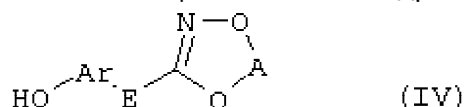
E - группа формулы



G - кислород или группа $-\text{CH}_2-\text{O}-$;

Z - фенил, пиримидинил, замещенные метилом, этилом, фтором, хлором, бромом, феноксигруппа, замещенная циано,

отличающийся тем, что гидроксиарилловые соединения общей формулы (IV)



где A, Ar и E имеют вышеуказанные значения,

подвергают взаимодействию с соединениями общей формулы (V)



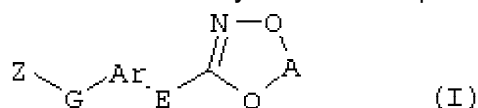
где Z имеет вышеуказанные значения;

m означает 0 или 1;

X означает галоген,

при необходимости в присутствии акцептора кислоты и при необходимости в присутствии разбавителя с последующим в случае необходимости переводением группы Z в желаемое значение и выделением целевого продукта.

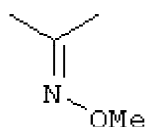
4. Способ получения замещенных азиодиоксициклоалкенов общей формулы (1)



где A - диметилен (этан-1,2-диил);

Ar - ортофенилен;

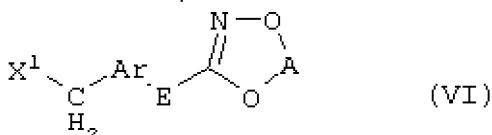
E - группа формулы



G - группа $-\text{O}-\text{CH}_2-$;

Z - фенил, замещенный метилом или этилом,

отличающийся тем, что галогенметилловые соединения общей формулы (VI)



где A, Ar и E имеют вышеуказанные значения;

X¹ означает галоген,

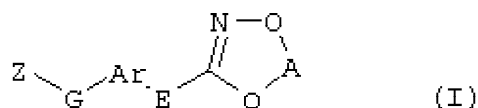
подвергают взаимодействию с соединениями общей формулы (VII)



где Z имеет вышеуказанное значение,

при необходимости в присутствии акцептора кислоты и при необходимости в присутствии разбавителя с последующим выделением целевого продукта.

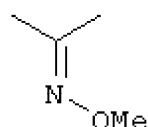
5. Способ получения замещенных азиодиоксициклоалкенов общей формулы (I)



где А - диметилен (этан-1,2-диил);

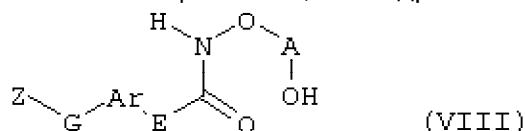
Ar - ортофенилен;

Е - группа формулы



G - группа -CH₂-O-;

Z - фенил, замещенный метилом или этилом, отличающийся тем, что гидроксикаламида общей формулы (VIII)

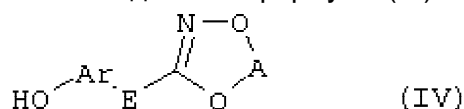


где

A, Ar, E, G и Z имеют вышеуказанные значения,

подвергают циклизации водоудаляющим средством при необходимости в присутствии разбавителя.

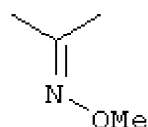
6. Соединения формулы (IV)



где А - диметилен (этан-1,2-диил);

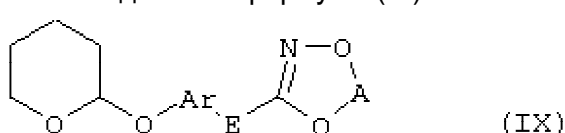
Ar - ортофенилен;

Е - группа формулы



в качестве промежуточных продуктов для соединений формулы (I).

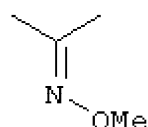
7. Соединения формулы (IX)



где А - диметилен (этан-1,2-диил);

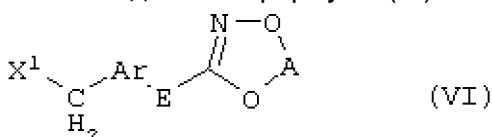
Ar - ортофенилен;

Е - группа формулы



в качестве промежуточных продуктов для соединений формулы (I).

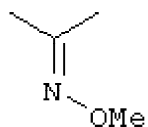
8. Соединения формулы (VI)



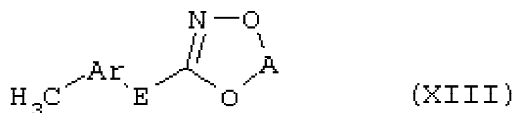
где

A - диметилен (этан-1,2-диил);

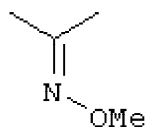
Ar - ортофенилен;
E - группа формулы



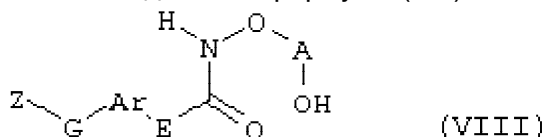
X¹ - галоген,
в качестве промежуточных продуктов для соединений формулы (I).
9. Соединения формулы (XIII)



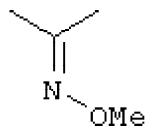
где A - диметилен (этан-1,2-диил);
Ar - ортофенилен;
E - группа формулы



в качестве промежуточных продуктов для соединений формулы (I).
10. Соединения формулы (VIII)



где A - диметилен (этан-1,2-диил);
Ar - ортофенилен;
E - группа формулы



G - группа -CH₂-O-;
Z - фенил, замещенный метилом,
в качестве промежуточных продуктов для соединений формулы (I).

11. Фунгицидные средства, отличающиеся тем, что они содержат соединение формулы (I) по п.1 в качестве активного вещества.

12. Способ получения фунгицидных средств по п.11, отличающийся тем, что соединения формулы (I) по п.1 смешивают с наполнителями и/или поверхностно-активными веществами.

13. Способ борьбы с нежелательными грибами, отличающийся тем, что соединениями формулы (I) по п.1 обрабатывают грибы и/или их биотоп.