



ЗАЯВКА ЗА ПАТЕНТ

ИЗОБРЕТЕНИЕ

(51) C07C251/60

A01N 37/00

(21) Заявителски № 100760			(71) Заявител(и):
(22) Заявено на 31.07.1996			BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, ., D-51368 LEVERKUSEN, . (DE) ;
(24) Начало на действие на патента от:			(72) Изобретател(и):
Приоритетни данни			ZIEGLER, Hugo ., 4108 Witterswil (CH) ;
(31)	12/94	(32) 05.01.1994	TRAH, Stephan ., D-79111 Freiburg (DE) ;
	2117/94	(33) 01.07.1994	FAROOQ, SALEEM ., ARISDORF (CH) ;
			ZURFLUEH, Rene ., 4052 Basel (CH) ;
(41)	Публикувана заявка в бюлетин № 3 31.03.1997		(74) Представител по индустриална собственост:
(45)	Отпечатано на		Георги Цветанов Перев, 1124 София, ул. "Леонардо да Винчи" 3
(46)	Публикувано в бюлетин № на		
(56)	Информационни източници:		
(62)	Разделена заявка от рег. №		
(86)	№ на PCT заявка:		
	PCT/ EP94/0 / 4318, 27.12.1994		
(87)	№ и дата на PCT публикация:		
	95/187 / 89, 13.07.1995		

(57) Съединения с формула и възможните техни изомери и изомерни смеси, в която формула или x е n -атом и y е $or11$, или $n(r12)r13$, или x е sn и y е $or11$, и освен това $r11$ е $c1-c4$ алкил; $r12$ и $r13$ означават поотделно водород или $c1-c4$ алкил; a е o -атом или групата $nr4$; $r1$ е водород, $c1-c4$ алкил, хало- $c1-c4$ алкил, циклопропил, циано или метилтио; $r2$ е водород, $c1-c6$ алкил, $c3-c6$ циклоалкил, гр упата групата или тиенил; $r3$ е водород, $c1-c6$ алкил, $c1-c6$ халоалкил, съдържащ от 1 до 5 халогенни атома, $c1-c4$ алкокси- $c1-c2$ алкил, $c2-c4$ алкенил- $c1-c2$ алкил, който е нез аместен или заместен с 1 до 3 халогенни атома, $c2-c4$ алкинил- $c1-c2$ алкил, $c3-c6$ циклоалкил, който е незаместен или заместен с 1 до 4 халогенни атома, $c3-c6$ циклоалкил- $c1-c4$ алкил, който е незаместен и ли заместен с 1 до 4 халогенни атома, циано- $c1-c4$ алкил; $c1-c4$ алкоксикарбонил- $c1-c2$ алкил, $c1-c4$ алкоксикарбамоил- $c1-c2$ алкил, фенил- $c1-c3$ алкил, който е незаместен или заместен с халоген, $c1-c3$ алки л, $c1-c4$ алкокси, $c1-c4$ халоалкил, циано, нитро, или $c1-c4$ алкилендиокси, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до тризаместена с еднакви или различни заместители, фенил, който е незам естен или монодо дизаместен поотделно с $c1-c4$ алкил, $c1-c4$ алкокси, халоген, $c1-c2$ халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атома, нитро или циано, или пиридил, който е незаместен или монозаместен до д изаместен поотделно с $c1-c4$ алкил, $c1-c4$ алкокси, халоген, $c1-c2$ халоалкил, съдържащ

BG 100760A

от 1 до 3 халогенни атома, нитро или циано; r4 е c1-c4 алкил, фенил или r3 и r4 заедно с азотния атом, с който са свързани, образуват наситен или ненаситен 5 до 7-членен пръстен, който е незаместен или заместен с c1-c4 алкил и може да включва допълнително от 1 до 3 хетероатома, избрани между n, o и s и в които заместителите z, v, d и n са със значения, дадени в описанието. Съединенията са активни пестицидни съставки, които могат да се използват за контрол на паразитите, по-специално като бактерициди, инсекти

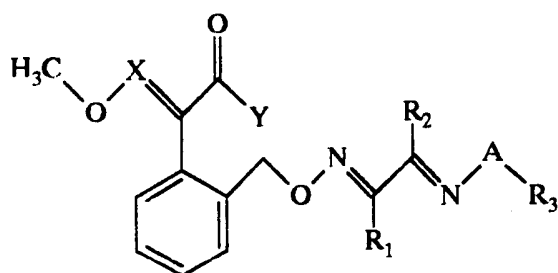
55 претенции , 0

31.07.98

582/96-ГП

ПЕСТИЦИДИ

Изобретението се отнася до нови пестицидно активни съединения с формула I,



и до възможните техни изомери и изомерни смеси, в които или

- a) X е N-атом и
Y е OR_{11} или $N(R_{12})R_{13}$, или
- b) X е CH и
Y е OR_{11}

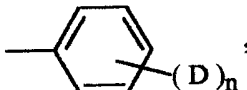
и в които освен това:

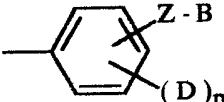
R_{11} е C_1 - C_4 алкил;

R_{12} и R_{13} означават поотделно водород или C_1 - C_4 алкил;

A е O-атом или групата NR_4 ;

R_1 е водород, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил, хало- $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил, циклопропил, циано или метилтио;

R_2 е водород, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкил, $\text{C}_3\text{-C}_6$ циклоалкил, групата ,

групата  или тиенил;

D-радикалите са еднакви или различни и представляват халоген,

$\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкокси, $\text{C}_1\text{-C}_2$ халоалкил, $\text{C}_1\text{-C}_2$ халоалкокси,

$\text{C}_3\text{-C}_6$ алкенилокси, $\text{C}_3\text{-C}_6$ алкинилокси, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилендиокси; циано или нитро;

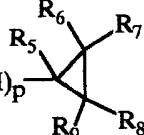
n е равно на 0, 1, 2, 3 или 4;

Z е $-\text{O}-$, $-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкил})-$, $-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкил})-\text{O}-$, $-\text{S}(\text{O})_m-$, $-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкил})-\text{S}(\text{O})_m-$, $-\text{S}(\text{O})_m-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкил})-$,

m е равно на 0, 1 или 2,

B е $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкил, хало- $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкил, $\text{C}_3\text{-C}_6$ циклоалкил или е $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкенил, или $\text{C}_2\text{-C}_4$ алкинил- $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкил, като всеки от радикалите е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми, или представлява арил или хетероциклил, като всеки от последните два радикала поотделно е незаместен или моно- до петзаместен с

$\text{C}_1\text{-C}_6$ алкил, хало- $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкил, халоген, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, или

хало- $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, или групата , или триметилсилил;

R_5 , R_6 , R_7 , R_8 и R_9 поотделно означават водород, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил или халоген, а

p е равно на 0, 1, 2 или 3;

R_3 е водород, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкил, $\text{C}_1\text{-C}_6$ халоалкил, съдържащ от 1 до 5 халогенни атоми, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкокси- $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкил, $\text{C}_2\text{-C}_4$ алкенил- $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми,

C_2-C_4 алкинил- C_1-C_2 алкил, C_3-C_6 циклоалкил, който е незаместен или заместен с 1 до 4 халогенни атоми, C_3-C_6 циклоалкил- C_1-C_4 алкил, който е незаместен или заместен с 1 до 4 халогенни атоми, циано- C_1-C_4 -алкил; C_1-C_4 алкоксикарбонил- C_1-C_2 алкил, C_1-C_4 алкокси-карбамоил- C_1-C_2 алкил, фенил- C_1-C_3 алкил, който е незаместен или заместен с халоген, C_1-C_3 алкил, C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 халоалкил, циано, нитро, или C_1-C_4 алкилендиокси, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до тризаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкокси, халоген, C_1-C_2 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, нитро или циано, или пиридил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкокси, халоген, C_1-C_2 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, нитро или циано;

R_4 е C_1-C_4 алкил, фенил или

R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, с който са свързани, образуват наситен или ненаситен 5- до 7-членен пръстен, който е незаместен или заместен с C_1-C_4 алкил и който може да включва допълнително от 1 до 3 хетероатоми, подбрани измежду N, O и S, с изключение на съединенията с формула I, в които

X е CH;

Y е OCH_3 ;

A е O-атом;

R_1 е водород и

R_3 е метил; тогава

R_2 е радикал, различен от фенил, който е заместен само с един или повече хлорни атоми.

Съединенията съгласно изобретението имат фунгицидни, акарицидни и инсектицидни свойства и са подходящи за използване

като активни съставки в земеделието, градинарството и за хигиенни цели.

Изобретението се отнася също до метод за получаване на съединенията съгласно настоящето изобретение и до фунгицидни, акарицидни и инсектицидни състави, които включват споменатите активни съставки, и до приложението на тези съединения и състави за контрол на фитопатогенните гъби, Ascarina и насекоми и за предотвратяване на развитието им.

Ако в съединенията с формула I участва асиметричен въглероден атом, тези съединения съществуват в оптически активна форма. Във всеки случай, те се явяват в [E] и/или [Z] форма, просто поради наличието на алифатни, оксиминови и хидразоновы двойни връзки. Може да съществува също и атропизомеризъм. Предназначението на формула I е да обхване всичките тези възможни изомерни форми и техните смеси, например рацемични смеси и всякакви [E/Z] смеси.

WO 90/07493 описва като фунгициди метилестери на алдимино и кетимино-оккси-орто-толилакрилната киселина, които се различават по структура от съединенията в настоящето изобретение.

В случай, че не е посочено друго, общите термини, използвани по-горе и в следващото описание, трябва да бъдат тълкувани в следния смисъл:

Халоген означава флуор, хлор, бром или йод, по-точно - флуор, хлор или бром и по-специално - флуор или хлор.

Алкил е или правоверижен, например метил, етил, n-пропил, n-бутил, n-хексил, n-октил, n-децил, n-додецил, n-хексадецил или n-октадецил, или радикал с разклонена верига, например изопропил, изобутил, sec-бутил, t-бутил, изопентил, неопентил или изохексил.

Алкенил е правоверижен или разклонен алкенил, например

винил, 1-метилвинил, алил, 1-бутенил, изопропенил и по-специално - алил.

Алкинил означава, например, етинил, 1-пропинил или 1-бутинил, по-специално - пропаргил.

Като циклоалкил трябва да се разбира циклопропил, циклобутил, циклопентил или циклохексил.

Заместените с халоген групи като халоалкилна и халоалкокси могат да бъдат частично или изцяло халогенирани с еднакви или различни заместители. Примери за халоалкил са метил, който е моно- до тризаместен с флуор, хлор и/или бром, например CHF_2 , CF_3 или CH_2Cl ; етил, който е моно- до петзаместен с флуор, хлор и/или бром, например CH_2CF_3 , CF_2CF_3 , CF_2CCL_3 , CF_2CHCl_2 , CF_2CHF_2 , CF_2CFCl_2 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$, CF_2CHBr_2 , CF_2CHClF , CF_2CHBrF или CClFCHClF ; като особено предпочитан е трифлуорометилът.

Правоверижна C_1 - C_4 алкилендиокси е $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{O}-$, $-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-$, $-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-$ или $-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-$.

Арил, например, е фенил или нафтил, по-специално фенил.

Хетероцикличът представлява 5- до 7-членен ароматен или неароматен пръстен, съдържащ от един до три хетероатоми, избрани от групата, състояща се от N, O и S. Предпочитани са ароматните 5- и 6-членни пръстени, които като хетероатом съдържат азотен атом и, ако е целесъобразно, и друг хетероатом, за предпочитане азот или сяра, най- добре - азот.

5- до 7-членният пръстен, който е образуван от R_3 и R_4 заедно с азотния атом, с който са свързани, обхваща по-специално пиролидин, пиперидин, морфолин, тиоморфолин, хексаметиленимин, имидазол, пиразол, пирол, 1,2,4-триазол, 1,2,3-триазол, тетразол, изоксазол, оксазол, изоксазолидин, оксазолидин, тиазол, изотиазол, тиазолин и изотиазолидин.

В областта, която изобретението обхваща, предпочитани са:

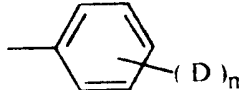
(1) Съединения с формула I, в които или

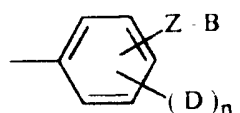
- a) X е N-атом и
Y е OCH_3 или NHCH_3 , или
- b) X е CH и
Y е OCH_3

и в които освен това:

A е O-атом или групата NR_4 ;

R_1 е водород, C_1 - C_4 алкил, хало- C_1 - C_4 алкил, циклопропил, циано или метилтио;

R_2 е водород, C_1 - C_6 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, групата ,

групата  или тиенил;

D-радикалите са еднакви или различни и представляват халоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_2 халоалкил, C_1 - C_2 халоалкокси, C_3 - C_6 алкенилокси, C_3 - C_6 алкинилокси, C_1 - C_4 алкилендиокси; циано или нитро;

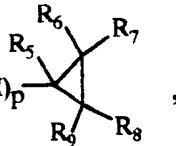
n е равно на 0, 1, 2, 3 или 4;

Z е $-\text{O}-$, $-\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{алкил})-$, $-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{алкил})-\text{O}-$, $-\text{S}(\text{O})\text{m}-$, $-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{алкил})-\text{S}(\text{O})\text{m}-$, $-\text{S}(\text{O})\text{m}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{алкил})-$,

m е равно на 0, 1 или 2,

B е C_1 - C_6 алкил, хало- C_1 - C_6 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил,

или е C_2 - C_6 алкенил, или C_2 - C_4 алкинил- C_1 - C_2 алкил, като всеки от радикалите е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми, или е арил или хетероцикл, или арил или хетероцикл, като всеки от последните поотделно е незаместен или монозаместен до петзаместен с C_1 - C_6 алкил, хало- C_1 - C_6 алкил, халоген, C_1 - C_6 алкокси,

или хало- C_1 - C_6 алкокси, или групата ,

R_5, R_6, R_7, R_8 и R_9 поотделно означаваат водород, C_1 - C_4 алкил или халоген, и

p е 0, 1, 2 или 3;

R_3 е водород, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 халоалкил, съдържащ от 1 до 5 халогенни атоми, C_1 - C_4 алкокси- C_1 - C_2 алкил, C_2 - C_4 алкенил- C_1 - C_2 алкил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми,

C_2 - C_4 алкинил- C_1 - C_2 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, който е незаместен или заместен с 1 до 4 халогенни атоми, C_3 - C_6 циклоалкил- C_1 - C_4 алкил,

който е незаместен или заместен с 1 до 4 халогенни атоми, циано-

C_1 - C_4 -алкил; C_1 - C_4 алкоксикарбонил- C_1 - C_2 алкил, фенил- C_1 - C_3 алкил,

който е незаместен или заместен с халоген, C_1 - C_3 алкил, C_1 -

C_4 алкокси, C_1 - C_4 халоалкил, циано, нитро, или C_1 - C_4 алкилендиокси,

като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до

тризаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е

незаместен или моно- до дизаместен поотделно с C_1 - C_4 алкил,

C_1 - C_4 алкокси, халоген, C_1 - C_2 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни

атоми, нитро или циано, или пиридил, който е незаместен или

монозаместен до дизаместен поотделно с C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси,

халоген, C_1 - C_2 халоалкил C_1 - C_2 халоалкил, съдържащ от 1 до 3

халогенни атоми, нитро или циано;

R_4 е C_1 - C_4 алкил или фенил, или

R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, към който са присъединени,

образуват наситен или ненаситен 5- до 7-членен пръстен, който е

незаместен или заместен с C_1 - C_4 алкил и който може да включва

допълнително 1 до 3 хетероатоми, избрани измежду N, O и S;

(2) Съединения с формула I, в които X е N и Y е OCH_3 ;

(3) Съединения с формула I, в които X е CH_3 ;

(4) Съединения с формула I, в които X е N, Y е $NHCH_3$ и R_1 е H,

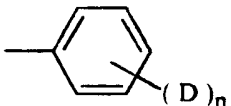
CH_3 , циклопропил или CN;

(5) Съединения с формула I, в които A е кислород, NCH_3 или

$n\text{-C}_6\text{H}_5$, по-специално кислород или NCH_3 и най-добре кислород;

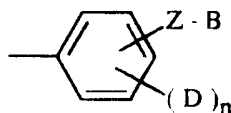
(6) Съединения с формула I, в които R_1 е водород, метил, циклопропил или циано, по-специално - метил;

(7) Съединения с формула I, в които R_2 е $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил или циклопропил, по-специално метил или циклопропил;

(8) Съединения с формула I, при които R_2 е групата  и

D е халоген, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкокси, $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкил, заместен с 1 до 5 халогенни атоми, $\text{C}_1\text{-C}_2$ халоалкокси, $\text{C}_3\text{-C}_6$ алкенилокси, $\text{C}_3\text{-C}_6$ алкинилокси, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилендиокси, циано, или нитро, или тиенил,

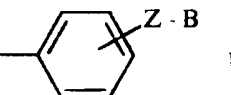
D е, по-специално, флуор, хлор, бром, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил или $-\text{CF}_3$;

(9) Съединения с формула I, при които R_2 е групата  и

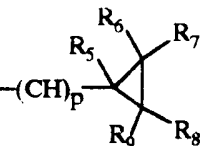
Z е $-\text{O}-$, $-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкил})-$, $-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкил})-\text{O}-$, $-\text{S}(\text{O})_2-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкил})-\text{S}(\text{O})_2-$, $-\text{S}(\text{O})_2-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкил})-$,

по-специално $-\text{O}-$, $-\text{CH}_2\text{-O}-$ или $-\text{O-CH}_2-$,

най-добре $-\text{O-CH}_2-$;

(10) Съединения с формула I, при които R_2 е групата  и

B е $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил, халоген- $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил, или $\text{C}_2\text{-C}_4$ алкенил, или $\text{C}_2\text{-C}_4$ алкинил- $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкил, всеки от които е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми, или е арил, или арил, моно- или дизаместен поотделно с $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкил, хало- $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкил, халоген, $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкокси,

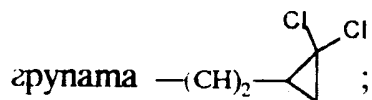
или хало- $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, или е групата ,

R_5 , R_6 , R_7 , R_8 и R_9 поотделно означават водород, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил или халоген, а

p е 0, 1, 2 или 3;

B, по-специално, е $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкил, хало- $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкил, или алил, или

пропаргил, всеки от които е незаместен или във всеки отделен случай заместен с 1 или 2 халогенни атоми, или с 1 или с 2 метилни групи, или фенил, или фенил, който е заместен със заместители, избрани от групата, включваща флуор, хлор, бром, CF₃, или



(11) Съединения с формула I, в които R₂ е фенилна група, заместена на 4-то място с -Z-B;

(12) Съединения с формула I, в които

R₃ е водород, C₁-C₆алкил или C₁-C₄халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, C₁-C₂алкокси-C₁-C₂алкил, C₁-C₄алкоксикарбонил-C₁-C₂алкил, пропенил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми, пропаргил, C₃-C₆циклоалкил, циклопропилметил, незаместен или заместен с 1 до 2 халогенни атоми, циано-

C₁-C₂алкил, фенил-C₁-C₂алкил, незаместен или заместен с халоген, метил, метокси или халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до дизаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или пиридил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или R₃ и R₄, заедно с азотния атом, към който са присъединени, образуват наситен или ненаситен 5- до 7-членен пръстен, който е незаместен или заместен с C₁-C₄алкил и който може да включва допълнително 1 до 3 хетероатоми, подбрани измежду N, O и S;

R₃ за предпочитане е водород, C₁-C₆алкил или C₁-C₄халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, C₁-C₂алкоксиметил, проп-2-1-ил, незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми, пропаргил,

C_3 - C_6 циклоалкил, циклопропилметил, незаместен или заместен с 1 до 2 флуорни или хлорни атоми, циано- C_1 - C_2 алкил, фенил- C_1 - C_2 алкил, който е незаместен или заместен с халоген, метил, метокси или халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до дизаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или пиридил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, към който са присъединени представляват 1,2,4-триазолил, 4-морфолинил, 1-азепинил, 1-пиперидинил или 1-пиролидинил,

Най-предпочитан като R_3 е метилът;

(13) Съединения с формула I, в които R_4 е метил или фенил и по-специално метил;

(14) Съединения с формула I, в които

X е CH; Y е OCH_3 ; R_1 е CH_3 ; A е кислород;

R_2 е или 4-метилфенил, или 4-алилоксифенил, или 4-(3-трифлуорометилбензилокси)фенил, или 4-(2,2-дихлороциклопропилметокси)-фенил и

R_3 е CH_3 ;

(15) Съединения с формула I, в които или

a) X е N-атом и

Y е OCH_3 или $NHCH_3$, или

b) X е CH и

Y е OCH_3

и в които освен това

A е O-атом или групата NR_4 ;

R_1 е водород; C_1 - C_4 алкил; циклопропил; циано или метилтио;

R_2 е водород; C_1 - C_6 алкил; C_3 - C_6 циклоалкил; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, C_1 - C_4 алкил; C_1 - C_4 алкокси; C_1 - C_2 халоалкил; C_1 - C_2 халоалкокси; C_3 - C_6 алкенилокси; C_3 - C_6 алкинилокси, C_1 - C_4 алкилендиокси, циано или нитро; тиенил;

R_3 е водород; C_1 - C_6 алкил; C_1 - C_6 халоалкил, съдържащ от 1 до 5 халогенни атоми; C_1 - C_4 алкокси- C_1 - C_2 алкил; C_2 - C_4 алкенил- C_1 - C_2 алкил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми;

C_2 - C_4 алкинил- C_1 - C_2 алкил; C_3 - C_6 циклоалкил, който е незаместен или заместен с 1 до 4 халогенни атоми; C_3 - C_6 циклоалкил- C_1 - C_4 алкил, който е незаместен или заместен с 1 до 4 халогенни атоми; циано- C_1 - C_4 алкил; C_1 - C_4 алкоксикарбонил- C_1 - C_2 алкил; фенил- C_1 - C_3 алкил, който е незаместен или заместен с халоген, C_1 - C_3 алкил,

C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 халоалкил, циано, нитро, C_1 - C_4 алкилендиокси, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до тризаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с

C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, халоген, C_1 - C_2 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, нитро или циано; пиридил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с

C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, халоген, C_1 - C_2 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, нитро или циано;

R_4 е C_1 - C_4 алкил; фенил; или

R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, към който са присъединени, образуват наситен или ненаситен 5- до 7-членен пръстен, който е незаместен или заместен с C_1 - C_4 алкил и който може да включва допълнително 1 до 3 хетероатоми, избрани измежду N, O и S.

(16) Съединения с формула I, в които

X е CH или N

Y е OCH_3

A е О-атом,,

R₁ е метил,

R₂ е метил; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, C₁-C₄алкил, C₁-C₄алкокси,

C₁-C₂алкил, който е заместен с 1 до 5 халогенни атоми, C₁-C₂хало-алкокси, C₃-C₆алкенилокси, C₃-C₆алкинилокси, C₁-C₄алкилендиокси, циано или нитро; или тиенил; и

R₃ е C₁-C₆алкил;

а X и Y са съгласно дефиницията за формула I.

(19) Съединения с формула I, в които

R₁ е метил,

R₂ е метил,

R₃ е съгласно даденото описание,

R₄ е метил или фенил, или

R₃ и R₄, заедно с азотния атом, към който са присъединени, образуват наситен или ненаситен 5- до 7-членен пръстен, който е незаместен или заместен с C₁-C₄алкил и който може да включва допълнително 1 до 3 хетероатоми, избрани измежду N, O и S.

като A, X и Y са съгласно дефиницията за формула I.

(20) Съединения с формула I, в които

R₃ е водород; C₁-C₄алкил; C₁-C₄халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми; C₁-C₂алкокси-C₁-C₂алкил; пропенил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми; пропаргил;

C₃-C₆циклоалкил; C₃-C₆циклоалкилметил, който е незаместен или заместен с 1 до 2 халогенни атоми; циано-C₁-C₂алкил; C₁-C₂алкокси-карбонил-C₁-C₂алкил; фенил-C₁-C₂алкил, който е незаместен или заместен с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано, нитро или C₁-C₂алкилендиокси, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до дизаместена поотделно с еднакви или различни заместители; фенил, който е

незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано, нитро; или пиридил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро;

R_4 е метил или фенил; или

R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, към който са присъединени, образуват наситен или ненаситен 5- до 7-членен пръстен, който е незаместен или заместен с C_1 - C_4 алкил и който може да включва допълнително 1 до 3 хетероатоми, избрани измежду N, O и S;

като A, X, Y, R_1 и R_2 са съгласно дефиницията за формула I.

(21) Тези от съединенията с формула I, упоменати в (20), в които R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, към който са присъединени, представляват триазолил, морфолинил, 2,6-диметилморфолинил, азепинил, пиперидил или пиролидинил.

(22) Съединения с формула I, в които

A е O-атом,,

R_1 е метил,

R_2 е метил; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси,

C_1 - C_2 алкил, който е заместен с 1 до 5 халогенни атоми, C_1 - C_2 халоалкокси, C_3 - C_6 алкенилокси, C_3 - C_6 алкинилокси, C_1 - C_4 алкилендиокси, циано или нитро; или тиенил; или

R_3 е водород; C_1 - C_4 алкил; C_1 - C_4 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми; C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкил; пропенил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми; пропаргил; C_3 - C_6 циклоалкил; C_3 - C_6 циклоалкилметил, който е незаместен или заместен с 1 до 2 халогенни атоми; циано- C_1 - C_2 алкил; C_1 - C_2 алкокси-карбонил- C_1 - C_2 алкил; фенил- C_1 - C_2 алкил, който е незаместен или заместен с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до

3 халогенни атоми, циано, нитро или C_1-C_2 алкилендиокси, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до дизаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или пиридил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро;

като X и Y са съгласно дефиницията за формула I.

(23) Тези от съединенията с формула I, упоменати в (22), в които

A е кислород,

R_1 е метил,

R_2 е метил; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, трифлуоро метил или трифлуорометокси; и

R_3 е метил.

(24) Съединения с формула I, в които

A е NCH_3 ,

R_1 е метил,

R_2 е метил; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, трифлуоро метил или трифлуорометокси;

R_3 е метил; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или пиридил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро;

като X и Y са съгласно дефиницията за формула I.

(25) Съединения с формула I, в които

X е N-атом,

Y е OR_{11} ,

R_{11} е C_1 - C_4 алкил и в които

A, R_1 , R_2 и R_3 са съгласно дефиницията за формула I.

(26) Тези от съединенията с формула I, упоменати в (25), в които

A е O-атом,

R_1 и R_2 са метил,

R_3 е водород; C_1 - C_4 алкил; C_1 - C_4 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми; C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкил; пропенил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми; пропаргил;

C_3 - C_6 циклоалкил; C_3 - C_6 циклоалкилметил, който е незаместен или заместен с 1 до 2 халогенни атоми; циано- C_1 - C_2 алкил; C_1 - C_2 алкокси-карбонил- C_1 - C_2 алкил; фенил- C_1 - C_2 алкил, който е незаместен или заместен с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано, нитро или C_1 - C_2 алкилендиокси, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до дизаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или пиридил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро;

(27) Тези от съединенията с формула I, упоменати в (26), в които R_3 е водород; C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_4 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми.

(28) Съединения с формула I, в които

X е N-атом,

Y е $N(R_{12})R_{13}$,

R_{12} и R_{13} поотделно са водород или C_1 - C_4 алкил; и в които

A, R_1 , R_2 и R_3 са съгласно дефиницията за формула I.

31.07.96

- 17 -

(29) Тези от съединенията с формула I, упоменати в (28), в които
Y е NH_2 , $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ или NHC_2H_5 ,

A е O-атом,

R_1 и R_2 са метил;

R_3 е водород; C_1 - C_4 алкил; C_1 - C_4 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми; C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкил; пропенил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми; пропаргил; C_3 - C_6 циклоалкил; C_3 - C_6 циклоалкилметил, който е незаместен или заместен с 1 до 2 халогенни атоми; циано- C_1 - C_2 алкил; C_1 - C_2 алкокси-карбонил- C_1 - C_2 алкил; фенил- C_1 - C_2 алкил, който е незаместен или заместен с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано, нитро или C_1 - C_2 алкилендиокси, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до дизаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано, нитро; или пиридил, който е незаместен, монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро;

(30) Тези от съединенията с формула I, упоменати в (29), в които
 R_3 е водород; C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_4 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми.

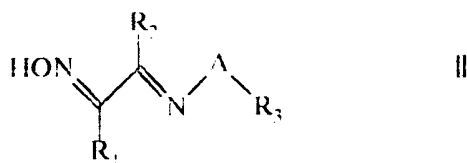
(31) Съединения с формула I, в които двойната връзка $\text{X}=\text{C}$ е в E-форма.

Съединенията с формула I могат да бъдат получени, както следва:

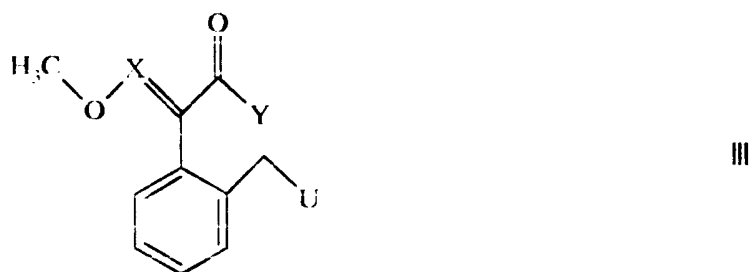
A) За да се получи съединение с формула I, в която Y е $\text{N}(\text{R}_{12})\text{R}_{13}$, съединение с формула I, където Y е OR_{11} , взаимодейства с $\text{HN}(\text{R}_{12})\text{R}_{13}$. Благоприятно е извършването на реакцията в среда на инертен органичен разредител, например в алкохол, като етанол, в

етер, като тетраhydroфуран или диоксан, в естер, като етилацетат, в сулфоксид, като диметилсулфоксид, в амид, като диметилформамид или в кетон, като метилизобутилкетон. Може да бъде използван и метиламин под формата на газ или в разтвор, например във вид на разтвор в етанол. Подходящата реакционна температура е в интервала между 0°C и 40°C, като предпочитана е стайната температура.

В) За получаване на съединение с формула I, в която X, Y, A и R₁-R₃ са съгласно дефиницията за формула I (и в което R₃ не е водород): Съединение с обща формула



в която A и R₁-R₃ са съгласно даденото по-горе определение, взаимодейства със съединение с обща формула



в която X и Y са съгласно дадената по-горе дефиниция, а U е отцепваща се група.

Реакцията е нуклеофилно заместване, което може да се извърши в обичайно използваните при такива случаи реакционни условия. Отцепващата група за предпочитане е хлор, бром, йод, мезилокси или тозилокси. Благоприятно е извършването на реакцията в среда на инертен органичен разредител, като цикличен етер, например тетраhydroфуран или диоксан, кетон, като ацетон, амид, като диметилформамид, сулфоксид, като диметилсулфоксид, в присъствието на основа от вида на натриев хидрид, натриев

карбонат, натриев амид, третичен амин, например триалкиламин, по-специално диазабициклононан, или диазабициклоундекан, или сребърен оксид, при температура между -20°C и 80°C , за предпочитане в температурния интервал от 0°C до 50°C .

Възможно е също реакцията да се извърши с обръщащ фазите катализатор в среда на органичен разтворител, например метиленхлорид, в присъствието на воден разтвор на основа, например разтвор на натриев хидроксид, и на обръщащ фазите катализатор, например тетрабутиламониев кисел сулфат, при стайна температура.

Получените съединения с формула I могат да бъдат изолирани и пречистени по известните в практиката методи. По същия начин, чрез използване на познатите в практиката методи, например посредством хроматография или функционална кристализация, могат да бъдат изолирани и пречистени и получените изомерни смеси, например E/Z изомерни смеси, до получаването на чисти изомери.

Използваните като изходни вещества оксими с обща формула II, са или познатите, или могат да бъдат получени по известните методи (J. Chem. Soc., Perkin Trans II 537 (1990); Ber. Deutsch. Chem. Ges. 62, 866 (1929); Gazz. Chim. Ital. 37, II, 147 (1907); Liebigs Ann. Chem. 262, 305 (1891)).

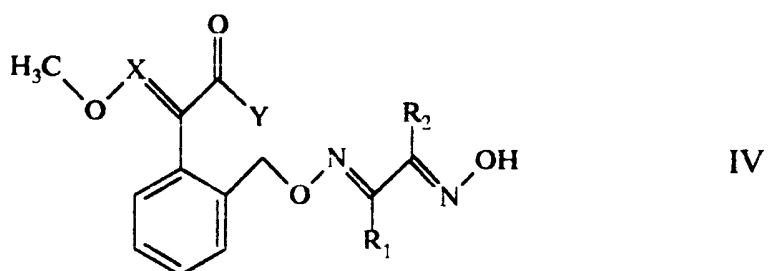
Аналогично, по някои от познатите в практиката начини могат да бъдат получени и изходните съединения с формула III, например съгласно описаното в European Patent Publication EP-A-203 606 (BASF) и в цитираната тук литература или съгласно описаното в Angew. Chem. 71, 349-365 (1959).

C) За получаване на съединение с формула I, в която A е кислород, а X, Y и R_1 - R_3 са съгласно дефиницията за формула I:

Съединение с обща формула

31.07.96

- 20 -



В която X, Y, R₁ и R₂ са съгласно даденото по-горе определение, взаимодейства със съединение с обща формула

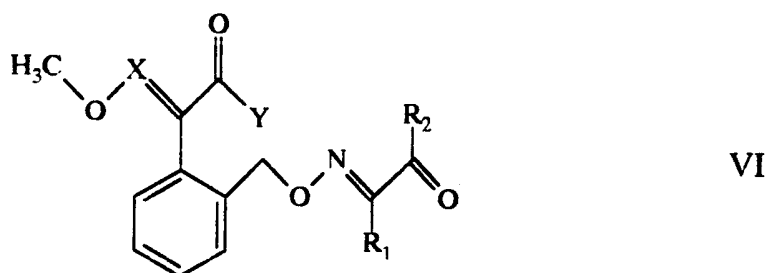


като R₃ е съгласно дефиницията за формула I, а U - съгласно дефиницията за формула III (и R₃ не е нито водород, нито фенил, нито пиридил).

Реакцията представлява нуклеофилно заместване, както беше описано в точка B).

D) За получаване на съединение с формула IV, в която X, Y и R₁ и R₂ са съгласно дефиницията за формула I, се изпълнява процедурата, при която:

Съединение с обща формула



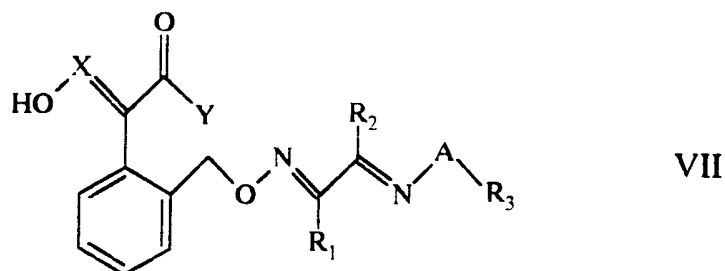
където X, Y и R₁ и R₂ са съгласно даденото по-горе определение, взаимодейства с хидроксиламин или с неговa сол, например с хидрохлорид. Благоприятно е реакцията да се извърши в разтворител, като пиридин или метанол, при температура между -20°C и +80°C или при температурата на кипене на метанола, за предпочитане в температурния интервал от 0°C до 50°C, като в случай, че се използва метанол, е необходима основа, например карбонат на алкален метал, като калиев карбонат, третилен амин,

като триетиламин или диазабициклононан, пиридин или сребърен оксид.

Кетонът с формула VI се получава аналогично на метода, описан в В). Кетоните с формула VI и тяхното получаване са описани, например, в EP-370 629, EP-506 149, EP-403 618, EP-414 153, EP-463 488, EP-472 300, EP-460 575, WO-92/18494 и в други публикации.

Е) За получаване на съединение с формула I, в която A, X, Y и R_1 - R_3 са съгласно дефиницията за формула I, но в която R_3 не е водород, се изпълнява процедурата, при която, например:

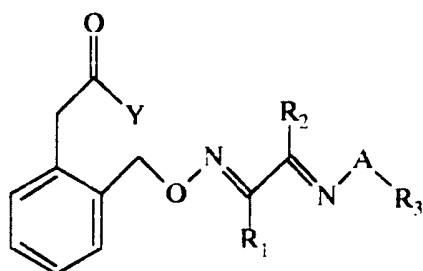
Съединение с формула



в която A, X, Y и R_1 - R_3 са съгласно даденото по-горе определение, взаимодейства с метилиращ агент, например метилйодид, диметилсулфат или диазометан. Благоприятно е реакцията да се извърши в присъствието на основа, например калиев карбонат или натриев хидрид, в подходящ разтворител и при подходящи реакционни температури (виж, например, H.S. Anker und H.T. Clarke, Organic Synthesis, Coll. Vol. 3, 172).

Ф) За получаване на съединение с формула VII, в която A, X, Y и R_1 - R_3 са съгласно дефиницията за формула I, е удачно да се изпълни процедурата, при която:

Съединение с формула

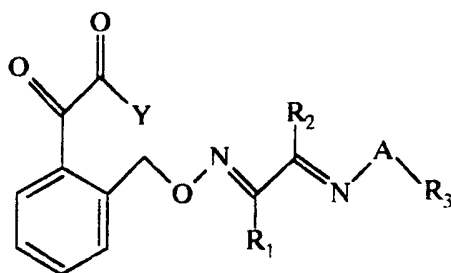


VIII

В която А, Y и R₁-R₃ са съгласно даденото по-горе определение, взаимодействия с формат в присъствието на основа, аналогично на метода, описан в EP-A-178 826, или се подлага на азотиране с азотна киселина или нитрит в присъствието на основа, аналогично на метода, описан в EP-A-254-426.

Следващата реакция представлява друга възможност за синтезиране на съединение с формула VII:

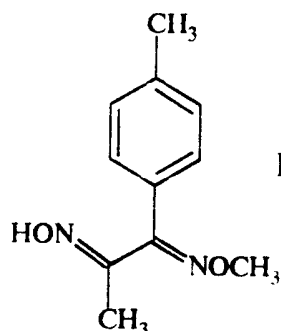
Съединение с формула



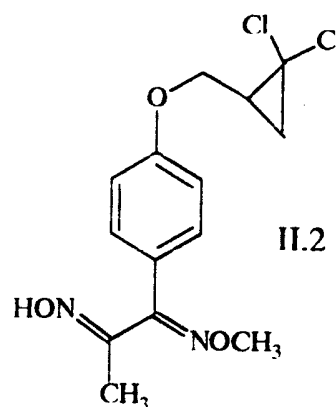
IX

В която А, Y и R₁ до R₃ са съгласно даденото по-горе определение, се подлага на взаимодействие с метоксиметилентрифенил фосфоран, аналогично на метода, описан в EP-A-178 826, или с О-метилхидроксиламин (или негова сол), аналогично на метода, описан в EP-A-254 426.

Изобретението осигурява също и новите съединения с формули II, VII, VIII и IX и по-специално съединенията с формули II.1 и II.2.



II.1



II.2

Установено е, че съединенията с формула I притежават широк бактерициден спектър за контрол на фитопатогенните микроорганизми, по-специално гъби, който е особено подходящ за практически цели. Съединенията имат полезни лечебни, предпазващи и, по-специално, системни свойства и могат да бъдат използвани за защита на голям брой растителни култури. При използване на активните съставки с формула I вредителите, откривани по растенията или по части от растенията (плодове, цветове, листа, стебла, грудки и корени) на различните видове полезни растения, могат да бъдат ограничени или унищожени и дори частите от растенията, развили се в по-късен период от време, остават свободни от фитопатогенни микроорганизми.

Съединенията с формула I могат да бъдат използвани също и като средства за обработка на семенни (плодоносни, грудкови, семенни) и разсадни култури за защитаването им от гъбични зарази и срещу развъждащи се в почвата фитопатогенни гъби.

Съединенията с формула I са активни например по отношение на фитопатогенните гъби, които принадлежат към следните класове: Fungi imperfecti (по-специално Botrytis, а също и Pyricularia, Helminthosporium, Fusarium, Septoria, Cercospora, Cercosporella и Alternaria); Basidiomycetes (например Rhizoctonia, Hemileia, Puccinia); Ascomycetes (например Venturia и Erysiphe, Podosphaera, Monilinia,

Uncinula); Oomycetes (например Phytophthora, Peronospora, Bremia, Pythium, Plasmopara).

Освен това съединенията с формула I са ценни активни съставки по отношение на инсектите и Asarina, откриващи се върху полезни насаждения и декоративни растения в земеделието и градинарството - по-специално ориз, памук, зеленчуци и плодове, и в горите, и се понасят добре от топлокръвните биологични видове, от рибите и растенията. Съединенията с формула I са особено подходящи за контрол на насекомите в оризените посеви, по плодовете и зеленчуците и особено за контрол на увреждащите растения насекоми. Други области на приложение на активните съставки от изобретението са защитата на съхранявани продукти и материали и в хигиенния сектор - по-специално за защита на домашните животни и на продуктивния добитък. Съединенията с формула I са активни към всичките или към отделни етапи от развитието на нормално чувствителните, а също така и на устойчивите видове вредители. Тяхната активност се проявява например в унищожаване на вредителите или незабавно, или след известен период от време, например по време на смяна на перушината на птиците, или в намаляване на интензивността на снасяне на яйца или на излюпването им.

Споменатите по-горе вредители при животните включват например:

От подклас Lepidoptera, например:

Acleris spp., Adoxophyes spp., Aegeria spp., Agrotis spp., Alabama argillaceae, Amylois spp., Anticarsia gemmatilis, Archips spp., Argyrotaenia spp., Autographa spp., Busseola fusca, Carda cautella, Carposina nipponensis, Chilo spp., Choristoneura spp., Clysia ambiguella, Cnaphalocrocis spp., Cnephasia spp., Cochylis spp., Coleophora spp., Crocidolomia binotalis, Cryptophlebia leucotreta, Cydia spp., Diatraea spp.,

Diparopsis castanea, *Earias* spp., *Ephestia* spp., *Eucosma* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., *Euxoa* spp., *Grapholita* spp., *Hedya nubiferana*, *Heliothis* spp., *Hellula undalis*, *Hyphantria cunea*, *Keiferia lycopersicella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocollethis* spp., *Lobesia botrana*, *Lymantria* spp., *Lyonetia* spp., *Malacosoma* spp., *Mamestra brassicae*, *Manduca sexta*, *Operophtera* spp., *Ostrinia nubilalis*, *Pammene* spp., *Pandemis* spp., *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phthorimaea operculella*, *Pieris rapae*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prays* spp., *Scirpophaga* spp., *Sesamia* spp., *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., *Synanthedon* spp., *Thaumetopoea* spp., *Tortrix* spp., *Trichoplusia ni* u *Yponomeuta* spp.;

Om nogklac Coleoptera, hanpumer,

Agriotes spp., *Anthonomus* spp., *Atomaria linearis*, *Chaetocnema tibialis*, *Cosmopolites* spp., *Curculio* spp., *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Eremnus* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus* spp., *Melolontha* spp., *Oryzaephilus* spp., *Otiorhynchus* spp., *Phlyctinus* spp., *Popillia* spp., *Psylliodes* spp., *Rhizopertha* spp., *Scarabeidae*, *Sithophilus* spp., *Sitotroga* spp., *Tenebrio* spp., *Tribolium* spp. u *Trogoderma* spp.;

Om nogklac Orthoptera, hanpumer,

Blatta spp., *Blattella* spp., *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Periplaneta* spp. u *Schistocerca* spp.;

Om nogklac Isoptera, hanpumer,

Reticulitermes spp.;

Om nogklac Psocoptera, hanpumer,

Liposcelis spp.;

Om nogklac Anoplura, hanpumer,

Haematopinus spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pemphigus* spp. u *Phylloxera* spp.;

Om nogklac Mallophaga, hanpumer,

Damalinae spp. u *Trichodectes* spp.;

Om nogklac Thysanoptera, hanpumer,

Frankliniella spp., Hercinothrips spp., Taeniothrips spp., Thrips palmi, Thrips tabaci u Scirtothrips aurantii;

Om nogklac Heteroptera, hanpumer,

Cimex spp., Distantiella theobroma, Dysdercus spp., Euchistus spp., Eurygaster spp., Leptocorisa spp., Nezara spp., Piesma spp., Rhodnius spp., Schilbergella singularis, Scotinophara spp. u Triatoma spp.;

Om nogklac Homoptera, hanpumer,

Aleurothrixus floccosus, Aleyrodes brassicae, Aonidiella spp., Aphididae spp., Aphis spp., Aspidiotus spp., Bemisia tabaci, Ceroplaster spp., Chrysomphalus aonidium, Chrysomphalus distyospermi, Coccus hesperidum, Empoasca spp., Eriosoma larigerum, Erythroneura spp., Gascardia spp., Laodelphax spp., Lecanium corni, Lepidosaphes spp., Macrosiphus spp., Myzus spp., Nephrotettix spp., Nilaparvata spp., Paratoria spp., Pemphigus spp., Planococcus spp., Pseudaulacaspis spp., Pseudococcus spp., Psylla spp., Pulvinaria aethiopica, Quadraspidotus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoideus spp., Schizaphis spp., Sitobion spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza erytrae u Unaspis citri;

Om nogklac Hymenoptera, hanpumer,

Acromyrmex, Atta spp., Cephus spp., Diprion spp., Diprionidae, Gilpinia polytoma, Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Neodiprion spp., Solenopsis spp. u Vespa spp.;

Om nogklac Diptera, hanpumer,

Aedes spp., Antherigona soccata, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Ceratitis spp., Chrysomyia spp., Culex spp., Cuterebra spp., Dacus spp., Drosophila melanogaster, Fannia spp., Gastrophilus spp., Glossina spp., Hypoderma spp., Hyppobosca spp., Liriomyza spp., Lucilia spp., Melanagromyza spp., Musca spp., Oestrus spp., Orseolia spp., Oscinella frit, Pegomyia hyoscyami, Phorbia spp., Rhagoletis pomonella, Sciara spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tannia spp. u Tipula spp.;

Om nogклас Siphonaptera, например,
Ceratophyllus spp. и Xenopsylla cheopis;

Om nogклас Thysanura, например,
Lepisma saccharina и

Om nogклас Acarina, например,

Acarus siro, Aceria sheldoni, Aculus schlechtendali, Amblyomma spp., Argas spp., Boophilus spp., Brevipalpus spp., Bryobia praetiosa, Calipitrimerus spp., Chorioptes spp., Dermanyssus gallinae, Eotetranychus carpini Eriophyes spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Olygonychus pratensis, Ornithodoros spp., Panonychus spp., Phyllocoptruta oleivora, Polyphagotarsonemus latus, Psoroptes spp., Rhipicephalus spp., Rhizoglyphus spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp. и Tetranychus spp..

Културите, обект на растителна защита, включени в изобретението са примерно следните типове: житни (пшеница, ечемик, ръж, овес, ориз, царевица, сорго и съответстващите им видове); цвекло (захарно и кърмно цвекло); ябълкови плодове, костилкови плодове и меки плодове (ябълки, круши, сливи, праскови, бадеми, череши, ягоди, малини и къпини); бобови растения (фасул, леща, грах, соя); маслодайни култури (маслодайна рапица, синап, мак, маслини, слънчоглед, кокосов орех, рициново семе, какао, фъстъци), тиквени (тикви, краставици, пъпеши); влакнодайни растения (памук, лен, коноп, юта); цитрусови плодове (портокали, лимони, грейпфрути, мандарини); зеленчуци (спанак, салати/марули, аспержи, зеле, моркови, лук, домати, картофи, чушки), фамилия лаврови (авокадо, канела, камфор) и растенията от вида на тютюн, орехи, кафе, патладжани, захарна тръстика, чай, пипер, лоза, хмел, семейство бананови, млечни и декоративни растения.

Действието на съединенията с формула I съгласно изобретението и на съдържащите ги състави може да бъде значително разширено и адаптирано към преобладаващите условия

чрез прибавяне на други бактерициди, инсектициди и/или акарициди. Примери за подходящи добавки са представителите на следващите класове активни съставки: органофосфорни съединения, нитрофеноли и техни производни, формамидини, уреи, карбамати, пиретроиди, хлорирани въглеводороди и препарати от *Bacillus thuringiensis*.

Обикновено активните съставки с формула I се прилагат под формата на състави и могат да бъдат нанасяни върху засятата площ или върху растенията, подлежащи на обработка, самостоятелно или в съчетание с други активни вещества. Тези други активни вещества могат да бъдат торове, микроелементимедиатори или други препарати, оказващи въздействие върху развитието на растенията. Могат да бъдат използвани също и селективни хербициди, както и инсектициди, фунгициди, бактерициди, нематициди и молускициди или смеси от няколко от тези препарати с или без обичайно използваните в практиката носители.

Подходящите носители или добавки могат да бъдат твърди или течни и включват веществата, които се използват обичайно при получаване на състави, например естествени или регенерирани минерални вещества, разтворители, диспергатори, омокрящи вещества, придаващи лепливост реактиви, съгъстители, свързващи вещества и торове.

Подходящите разтворители са: ароматни въглеводороди, за предпочитане фракциите C_8 до C_{12} , например ксиленови смеси или заместени нафталени, фталати, като дибутилфталат или диоктилфталат, алифатни въглеводороди, като циклохексан или парафини, алкохоли и гликоли както и техни етери и естери, като етанол, етиленгликол, етиленгликол монометилетер или етилетер, кетони, като циклохексанон, силно полярни разтворители, като N-

метил-2-пиролидон, диметилсулфоксид или диметилформамид и неепоксидирани или епоксидирани растителни масла, като епоксидирано кокосово масло или соево масло; или вода.

Обикновено използваните твърди носители, например много фини прахове (пудри) и диспергируеми прахове, представляват раздробени естествени скални материали като калцит, талк, каолин, монтморилонит или атапулгит.

Особено подходящи подобряващи нанасянето добавки, които могат да доведат до намаляване на интензивността на нанасяне, са естествените (животински и растителни) или синтетичните фосфолипиди от серията на кефалини и лецитини, които могат да бъдат получени например от соя.

В зависимост от природата на активната съставка с формула I, която ще бъде включена в състава, подходящите повърхностно активни съединения са нейонни, катионни и/или анионни повърхностно активни вещества, които имат добри емулгиращи, диспергиращи и омокрящи свойства. Като повърхностно активни вещества трябва да се разбират и техните смеси.

Подходящи анионни повърхностно активни съединения могат да бъдат така наречените водоразтворими соли, а също и водоразтворимите синтетични повърхностно активни вещества.

Сапуни са солите на алкалните и алкалоземните метали, или заместени или незаместени амониеви соли на по-висшите мастни киселини ($C_{10}-C_{20}$), например натриеви или калиеви соли на олеиновата или стеариновата киселина, или на естествени смеси от мастни киселини, които могат да бъдат получени например от кокосово масло или лой. Трябва да бъдат споменати и метил-тауратите на мастните киселини.

Подходящи нейонни повърхностно активни вещества са полиглицолетерните производни на алифатните или цикло-алифатните алкохоли, наситените или ненаситените мастни киселини и алкилфеноли, които притежават от 3 до 30 глицолетерни групи, от 8 до 20 въглеродни атоми във въглеводородния (алифатен) радикал и от 6 до 19 въглеродни атоми в алкилния радикал на алкилфенолите.

Примерите за нейонни повърхностно активни вещества включват нонилфенолполиетоксиетаноли, рициново масло, полиглицолетери, полипропилен/полиетиленоксидни адукти, трибутилфеноксиполиетоксиетанол, полиетиленглицол и октилфеноксиполиетоксиетанол.

Други подходящи вещества са мастнокиселинните естери на полиоксиетилен сорбитана като полиоксиетилен сорбитантриолеат.

Катионните повърхностно активни вещества са предимно кватернерни амониеви соли, които като N-заместители съдържат поне един алкилен радикал с 8 до 22 въглеродни атоми и, като следващи заместители, нисш халогенран или свободен алкил, бензил или нисши хидроксиалкилни радикали.

Обикновено, агрохимичните препарати съдържат от 0.1 до 99%, по-специално от 0.1 до 95% активна съставка с формула I, от 99.9 до 1%, по-точно от 99.9 до 5% твърда или течна добавка и от 0 до 25%, по-специално от 0.1 до 25% повърхностно активно вещество.

Въпреки че предпочитани като търговски продукти са концентрираните състави, крайният потребител обикновено използва разредени състави.

За постигане на специфичния им ефект съставите могат да съдържат също и други добавки от типа на стабилизатори,

антипенители, регулатори на вискозитета, свързващи вещества, придаващи лепливост реактиви, торове и други активни съставки.

Съставите, т.е. композиции, препарати и комбинации, съдържащи активна съставка с формула I, заедно с или без твърда или течна добавка, се получават по познатите начини, например чрез интимно смесване и/или смилане на активната съставка с инертно вещество, например разтворител (смес), твърд носител и, ако е целесъобразно, повърхностно активни вещества.

Предпочитан метод за нанасяне на дадена активна съставка с формула I или на агрохимичен състав, който съдържа поне една такава активна съставка, е нанасянето върху листната част (листово нанасяне). Честотата и интензивността на нанасяне зависят от опасността растенията да бъдат атакувани от въпросните патогени. Активните съставки с формула I, обаче, могат да достигнат до растението и през почвата по кореновата му система (системно действие) при поливане на почвата около растението с течен препарат или чрез смесване на веществата в твърдата им форма с почвата, например във вид на гранули (почвено нанасяне). В случай, че растението, което се обработва, е неолющен ориз, споменатите гранули могат да бъдат дозирани в обводнените оризища. Друга възможност е съединенията с формула I да бъдат нанесени върху семенната ядка (обвиване), или чрез накисване на семената в течен препарат от активната съставка, или чрез покриването им с твърд препарат. По принцип, чрез използване на съединенията с формула I може да бъде защитен всеки елемент от развиващото се растение, например семена, корени или стъбла.

Съединенията с формула I могат да се прилагат като чисти съединения или, за предпочитане, заедно с използваните обичайно при изготвянето на състави добавки. За тази цел е удачно

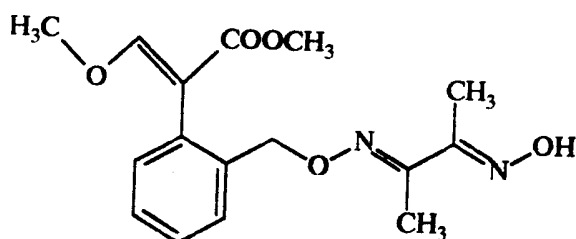
преработването им по познатия начин, например до получаване на емулсионни концентрати, разстилащи се пасты, директно разпръсквани или разреждани разтвори, разреждени емулсии, омокряеми прахове, разтворими прахове, фини прахове, гранули, капсуловани вещества, например в полимерни съединения. Методите за нанасяне, като пръскане, пулверизиране, чрез мъгла от фин прах, разхвърляне, нанасяне на покритие или заливане, както и видът на съставите се подбират така, че да бъдат съобразени с целите, за които са предназначени и с преобладаващите условия. Подходящите количества от нанасяното вещество са обикновено от 1 g до 2 kg активна съставка (a.i.) на хектар, за предпочитане от 25 g до 800 g активна съставка на хектар и по-специално от 50 g до 400 g активна съставка на хектар. Когато съставите се прилагат като продукти за обработка на посевни семена, подходящо е да се използват дозировки от 0.001 g до 1.0 g активна съставка на килограм семе.

Следващите примери са предназначени да илюстрират по-подробно изобретението, без да го ограничават по каквито и да е начин.

Примери на получаване на съединенията

Пример Н-1:

Получаване на

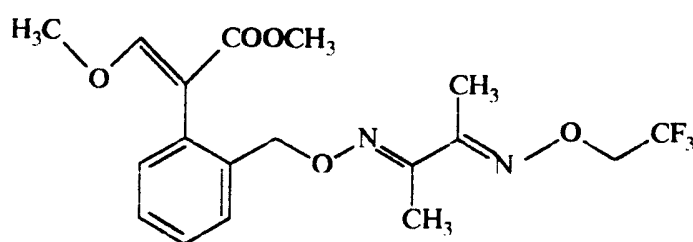


1.32 g хидроксиламин хидрохлорид се прибавят към разтвор на 5.2 g метил-3-метокси-2-[[[(3-оксо-2-бутил)имино]окси]о-толил]-акрилат (EP-A-370 629, No. 156) в 20 ml пиридин. След разбъркване на сместа 6 часа при 30°C се прибавя ледена вода. Кристалната маса,

която се образува след няколко часа, се отделя чрез филтруване и кристалите се измиват с вода. След прекристализиране в етанол/вода се получават 4.8 g метил-3-метокси-2-[[[(3-хидроксимино-2-бутил)имино]окси)о-толил]-акрилат (Съединение No. 1.73) под формата на жълти кристали с температура на топене 104-107°C.

Пример H-2:

Получаване на



През тръбичка под налягане към 0.2 g около 65% суспензия на натриев хидрид, измита с вода, се прибавят 5 ml диметил-формамид. След това се добавят 1.6 g метил-3-метокси-2-[[[(3-хидроксимино-2-бутил)имино]окси)о-толил]акрилат и след него 1.1 g 2,2,2-трифлуороетилйодид. Когато затихне отделянето на водород, намиращата се под налягане тръбичка се запушва и сместа се разбърква 5 часа при 50°C. Тогава реакционният разтвор се излива в ледена вода, екстрахира се с етилацетат и полученото вещество се хроматографира върху силикагел при елуиране с етилацетат/хексан (1:3). Получават се 1.2 g метил-3-метокси-2-[[[(3-(2,2,2-трифлуороетоксиимино)-2-бутил)имино]окси)о-толил]-акрилат (Съединение No. 1.74) под формата на безцветно масло.

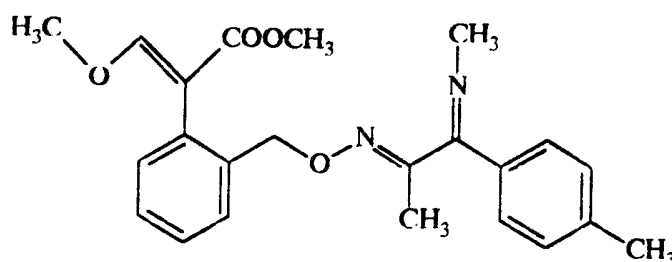
^1H ЯМР в CDCl_3 : химично изместване на двете имино-заместени метилни групи: 1.99 и 2.04 ppm.

Пример H-3:

Получаване на

31.07.98

- 34 -



Разтвор на 15.0 g p-метилпропиофенон и 20 ml изопентилнитрит в 30 ml метанол се прибавя бавно, на капки към 20 ml натриев метилат (30% в метанол). След разбъркване в продължение на 5 часа на капки се добавят 30 ml вода и впоследствие сместа се подкислява с оцетна киселина. Екстрахира се с етилацетат и екстрактът се измива с вода, изсушава се (Na_2SO_4) и се концентрира във вакуум. Остатъкът се прекристализира в диетилетер/п-хексан. Получава се α -хидроксиимино-4-метилпропиофенон под формата на безцветни кристали с температура на топене 122-124°C.

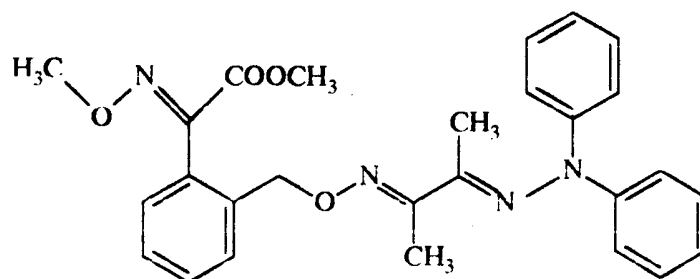
8.1 g от така полученото съединение и 4.6 g o-метилхидроксиламин хидрохлорид в 40 ml пиридин се загряват 1 час на обратен хладник. След добавяне на толуен сместа се концентрира във вакуум, обработва се с вода и се екстрахира с етилацетат. Органичната фаза се измива с вода, изсушава се над натриев сулфат и се концентрира във вакуум. α -Хидроксиимино-4-метилпропиофенон О-метилоксимът изкрис­та­ли­зи­ра в диетил етер/п-хексан под формата на безцветни кристали с температура на топене 156-157°C.

1.87 g от предварително получения оксим и 2.58 g метил-2-(α -бромо-о-толил)-3-метоксиакрилат се прибавят към суспензия на 0.41 g натриев хидрид в 25 ml N,N-диметилформамид и реакционната смес се разбърква в продължение на 3 часа. Последната се подкислява с оцетна киселина, обработва се с вода и се екстрахира с етилацетат. Органичната фаза се измива двукратно с наситен разтвор на натриев кисел карбонат и

еднократно с наситен разтвор на натриев хлорид. След изсушаване над безводен натриев сулфат разтворителят се отгестилира във вакуум. Съединението Н-3 изкрystalизира в диетилетер/п-хексан под формата на безцветни кристали с температура на топене 98-101°C (Съединение No.1.117).

Пример Н-4:

Получаване на

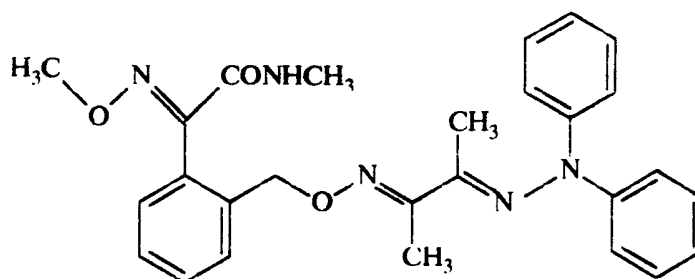


0.37 g от приблизително 65% суспензия на натриев хидрид се измива с хексан и се прибавят 10 ml диметилформамид. Към суспензията се добавя смес от 2.59 g метил-2-(2-бромометил-фенил)глиоксилат О-метилоксим и 2.42 g 2-(дифенилхидразоно)-3-хидроксиминобутан и сместа се загрява до 40-50°C чрез обдухване с горещ въздух, докато започне бурно отделяне на водород. След това сместа се разбърква един час, като се изключи възможността от овлажняване, и се излива в ледена вода. След екстрахиране с етилацетат и хроматографиране върху силикагел, елуиран с етилацетат/хексан (1:2) се получават 3.7 g метил-2-[[[(3-дифенилхидразоно-2-бутил)имино]окси)о-толил]глиоксилат О-метилоксим (Съединение No. 2.19) под формата на жълто масло.

^1H ЯМР в CDCl_3 : химично изместване на двете имино-заместени метилни групи: 1.64 и 2.12 ppm.

Пример Н-5:

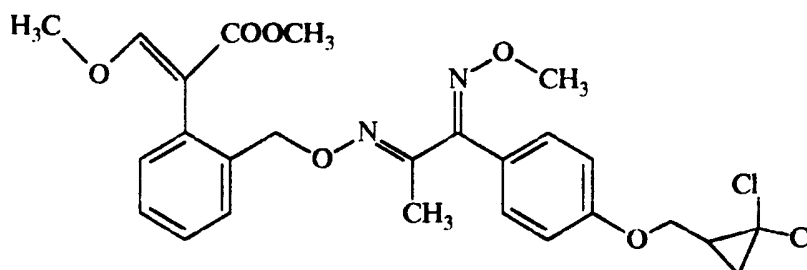
Получаване на



1.9 g метил-2-[[{(3-дифенилхидразоно-2-бутил)имино}окси)о-толил]глиоксилаат О-метилоксим се разбъркват 2 часа при стайна температура в 10 ml 33% разтвор на метиламин в етанол. Отгестилират се етанолът и излишъкът от метиламин. Остатъкът се разтваря в диетилетер, разтворът се филтрува и филтратът се изпарява до сухо, при което се получава кристално твърдо вещество. След измиване с хексан се получават 1.8 g N-монометил-2-[[{(3-дифенилхидразоно-2-бутил)имино}окси)о-толил]-глиоксиламид О-метилоксим (Съединение No. 3.19) под формата на светло бежови кристали с температура на топене 135-136°C.

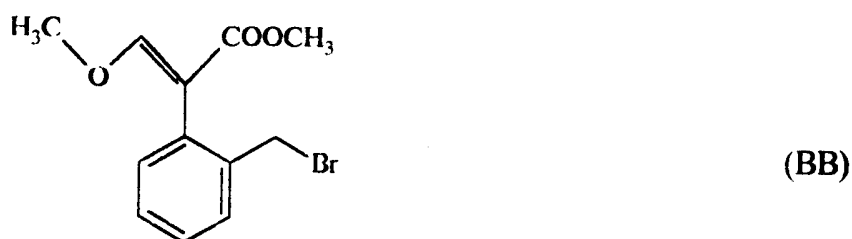
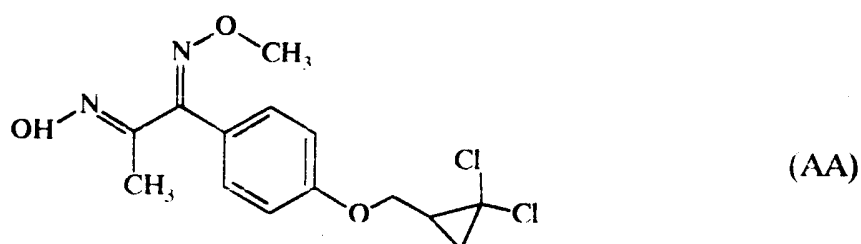
Пример Н-6:

Получаване на



1.74 g 1-[4-(2,2-дихлороциклопропилметокси)фенил]пропан-1,2-дион 1-(О-метилоксим)-2-оксим с формула (АА) се прибавят към 0.13 g натриев хидрид в 25 ml N,N-диметилформамид. Добавят се 1.5 g метил 2-(2-бромометилфенил)-3-метоксиакрилат с формула (ВВ) и сместа се разбърква 3 часа при стайна температура. Сместа се подкислява с оцетна киселина и се добавят вода и етилацетат. Водната фаза се отделя, а органичната се измива еднократно с наситен разтвор на кисел натриев карбонат и се изсушава над

безводен натриев сулфат. Разтворителят се изпарява във вакуум и полученият остатък се пречиства върху силикагел при елуиране с хексан/етилацетат (3:1). Получава се титулното съединение под формата на масло. След разделяне чрез колонна хроматография върху силикагел (хексан:етилацетат 3:1) се получават три изомера: изомер А, температура на топене 86-88°C, изомер В, масло, изомер С, масло (Съединение 5.9).



По този или по аналогичен на един от посочените по-горе методи начин могат да бъдат получени следващите съединения:

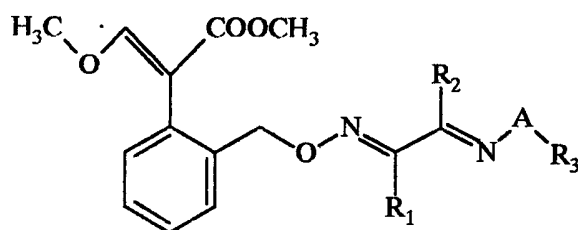
(Съкращения: Me = метил, Et = етил, Δ = циклопропил, Ph = фенил, т.т. = температура на топене).

ЯМР: Химичните измествания са дадени като δ (ppm) в CDCl₃.

31.07.95

- 38 -

Таблица I



Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
1.1	NMe	Me	Me	6-CF ₃ -2-пиридил	2.17/2.19
1.2	NMe	H	Me	6-CF ₃ -2-пиридил	
1.3	NMe	Me	Δ	6-CF ₃ -2-пиридил	
1.4	NMe	Me	H	фенил	
1.5	NMe	Me	Me	фенил	2.09/2.18
1.6	NMe	Δ	Me	фенил	
1.7	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -2-пиридил	m.m. 100°C
1.8	NMe	H	Me	4-CF ₃ -2-пиридил	
1.9	NMe	Δ	Δ	фенил	
1.10	NMe	Me	Me	5-CF ₃ -2-пиридил	2.17/2.18
1.11	NMe	H	Me	5-CF ₃ -2-пиридил	
1.12	-	H	Me	4-(1,2,4-триазолил)	
1.13	-	Me	Me	4-(1,2,4-триазолил)	161-163°C
1.14	-	Me	Δ	4-(1,2,4-триазолил)	
1.15	-	Me	Δ	4-морфолинил	
1.16	-	Me	Me	4-морфолинил	113°C
1.17	-	H	Me	4-морфолинил	
1.18	NPh*	H	Me	фенил	
1.19	NPh*	Me	Me	фенил	1.74/2.22
1.20	NPh*	Me	Δ	фенил	
1.21	NPh*	Δ	Me	фенил	
1.22	NMe	Me	Me	2-нитрофенил	1.93/2.06

31.07.98

- 39 -

Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
1.23	NMe	H	Me	2-нитрофенил	
1.24	O	Me	Me	Me	76-78°C
1.25	O	H	Me	Me	1.97/7.68
1.26	O	Δ	Me	Me	1.96/2.00
1.27	O	Me	Δ	Me	60-62°C
1.28	O	Me	H	Me	
1.29	NMe	H	Me	3-CF ₃ -2-пиридил	
1.30	NMe	Me	Me	3-CF ₃ -2-пиридил	2.06/2.18
1.31	NMe	Δ	Me	3-CF ₃ -2-пиридил	
1.32	NMe	Δ	Me	3-нитро-2-пиридил	
1.33	NMe	H	Me	3-нитро-2-пиридил	
1.34	NMe	Me	Me	3-нитро-2-пиридил	1.94/2.26
1.35	NMe	Me	Me	2-CF ₃ -фенил	1.85/2.10
1.36	NMe	Me	Δ	2-CF ₃ -фенил	
1.37	NMe	H	Me	2-CF ₃ -фенил	
1.38	NMe	Me	Me	3-CF ₃ -фенил	
1.39	NMe	Me	Δ	3-CF ₃ -фенил	
1.40	NMe	H	Me	4-CF ₃ -фенил	
1.41	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -фенил	
1.42	NMe	Me	Me	2-хлорофенил	1.73/2.13
1.43	NMe	Me	Me	3-хлорофенил	2.12/2.17
1.44	NMe	H	Me	4-хлорофенил	
1.45	NMe	Me	Me	4-хлорофенил	2.10/2.15
1.46	O	Me	Me	фенил	2.14/2.22
1.47	O	Me	Δ	фенил	
1.48	O	Me	Me	бензил	106-108°C
1.49	O	Me	Me	Et	1.92/1.95
1.50	O	H	Me	Et	

31.07.98

- 40 -

Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Фізичні данні**
1.51	O	Δ	Me	Et	
1.52	O	Me	Δ	Et	
1.53	O	Me	H	Et	
1.54	O	H	Me	метоксиметил	
1.55	O	Me	Me	метоксиметил	83-84°C
1.56	O	Me	Δ	метоксиметил	
1.57	O	Δ	Me	метоксиметил	
1.58	O	Me	Me	етоксиметил	2.04/2.04
1.59	O	H	Me	цианометил	
1.60	O	Me	Me	цианометил	2.04/2.04
1.61	O	Δ	Me	цианометил	
1.62	-	Me	Me	азепино	2.02/2.04
1.63	-	Me	Me	пиперидино	
1.64	-	Me	Me	пиролуидино	
1.65	O	H	Me	t-бутил	
1.66	O	Me	Me	t-бутил	1.96/2.04
1.67	O	Me	Me	пропаргил	114-115°C
1.68	O	Δ	Me	пропаргил	
1.69	O	Me	Δ	пропаргил	
1.70	O	Me	Me	2,2-дихлоро- циклопропилметил	2.02/2.02
1.71	O	Δ	Me	2,2-дихлоро- циклопропилметил	
1.72	O	H	Me	H	
1.73	O	Me	Me	H	104-107°C
1.74	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂	1.99/2.04
1.75	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂	
1.76	O	Me	H	CF ₃ CH ₂	

31.07.98

- 41 -

Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
1.77	O	Me	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
1.78	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
1.79	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	2.10/2.13
1.80	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
1.81	NMe	Me	Me	Me	94-98°C
1.82	NMe	Me	Δ	Me	
1.83	O	Me	Me	CH ₂ -CCl=CH ₂	80°C
1.84	O	Δ	Me	CH ₂ -CCl=CH ₂	
1.85	O	Me	Me	пропил	
1.86	O	Me	Me	бутил	36-38°C
1.87	O	Me	Me	гексил	1.99/2.01
1.88	O	Me	Me	метоксикарбонил- метил	90-93°C
1.89	O	H	Me	метоксикарбонил- метил	
1.90	O	Me	Me	3-флуоробензил	2.00/2.04
1.91	O	Me	Me	4-хлоробензил	
1.92	O	Me	Me	2-хлоробензил	
1.93	O	Me	Me	2-CF ₃ -бензил	
1.94	O	Me	Me	3-CF ₃ -бензил	56-58°C
1.95	O	Me	Me	4-CF ₃ -бензил	
1.96	O	Me	Me	3,4-дихлоробензил	
1.97	O	Me	Me	2,4,6-триметилбензил	
1.98	O	Me	Me	4-хлоро-2-нитробензил	
1.99	O	Me	Me	3-метоксибензил	
1.100	O	Me	Me	2-фенетил	1.97/2.02
1.101	O	Me	Me	3-фенилпропил	
1.102	O	Me	Me	2-(4-нитрофенил)етил	

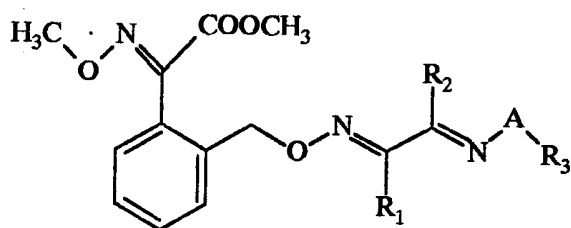
31.07.98

- 42 -

Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
1.103	O	Me	Me	2-(2-CF ₃ -фенил)етил	
1.104	O	Me	Me	2-(4-метоксифенил)етил	
1.105	O	Me	Me	2-хлоро-6-флуоробензил	
1.106	O	Me	Me	3,4-метилендиоксибензил	
1.107	O	Me	Me	2-цианобензил	
1.108	O	Me	Me	2-(4-хлорофенил)етил	
1.109	O	Me	Me	циклопропилметил	2.01/2.01
1.110	O	Me	Me	2-(1,3-диоксоланил)метил	
1.111	O	Me	Me	2,2,3,3-тетрафлуоро- циклобутилметил	
1.112	O	Me	Me	α-флуороетокси- карбонилметил	
1.113	O	Me	2-тиенил	Me	2.06/2.10/ 2.20 (E/Z)
1.114	O	Me	4-метил- фенил	Et	2.12
1.115	NMe	Me	4-метил- фенил	Me	2.10(изом.1) 2.08(изом.2)
1.116	O	Me	Me	CH ₂ FCH ₂	50-51°C
1.117	O	Me	Me	2-(4-морфолино)етил	1.99/2.01
1.118	-	Me	Me	1-пирил	89-91°C
1.119	O	Me	Me	2-(1-пиперидино)етил	
1.120	O	Me	Me	2-флуоробензил	93-96°C
1.121	O	Me	Me	4-флуоробензил	104-106°C

** температура на топене или ¹H ЯМР на R₁/R₂ или R₃

Таблица 2



Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
2.1	NMe	Me	Me	6-CF ₃ -2-пиридил	87-88°C
2.2	NMe	H	Me	6-CF ₃ -2-пиридил	
2.3	NMe	Me	Δ	6-CF ₃ -2-пиридил	
2.4	NMe	Me	H	фенил	
2.5	NMe	Me	Me	фенил	
2.6	NMe	Δ	Me	фенил	
2.7	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -2-пиридил	
2.8	NMe	H	Me	4-CF ₃ -2-пиридил	
2.9	NMe	Δ	Δ	фенил	
2.10	NMe	Me	Me	5-CF ₃ -2-пиридил	
2.11	NMe	H	Me	5-CF ₃ -2-пиридил	1.64/2.12
2.12	-	H	Me	4-(1,2,4-триазаолил)	
2.13	-	Me	Me	4-(1,2,4-триазаолил)	
2.14	-	Me	Δ	4-(1,2,4-триазаолил)	
2.15	-	Me	Δ	4-морфолинил	
2.16	-	Me	Me	4-морфолинил	
2.17	-	H	Me	4-морфолинил	
2.18	NPh	H	Me	фенил	
2.19	NPh	Me	Me	фенил	
2.20	NPh	Me	Δ	фенил	
2.21	NPh	Δ	Me	фенил	
2.22	NMe	Me	Me	2-нитрофенил	
2.23	NMe	H	Me	2-нитрофенил	

31.07.98

- 44 -

Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
2.24	O	Me	Me	Me	104-106°C
2.25	O	H	Me	Me	
2.26	O	Δ	Me	Me	1.92/1.97
2.27	O	Me	Δ	Me	60-70°C
2.28	O	Me	H	Me	
2.29	NMe	H	Me	3-CF ₃ -2-пиридил	
2.30	NMe	Me	Me	3-CF ₃ -2-пиридил	
2.31	NMe	Δ	Me	3-CF ₃ -2-пиридил	
2.32	NMe	Δ	Me	3-нитро-2-пиридил	
2.33	NMe	H	Me	3-нитро-2-пиридил	
2.34	NMe	Me	Me	3-нитро-2-пиридил	
2.35	NMe	Me	Me	2-CF ₃ -фенил	
2.36	NMe	Me	Δ	2-CF ₃ -фенил	
2.37	NMe	H	Me	2-CF ₃ -фенил	
2.38	NMe	Me	Me	3-CF ₃ -фенил	
2.39	NMe	Me	Δ	3-CF ₃ -фенил	
2.40	NMe	H	Me	4-CF ₃ -фенил	
2.41	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -фенил	
2.42	NMe	Me	Me	2-хлорофенил	81°C
2.43	NMe	Me	Me	3-хлорофенил	2.10/2.13
2.44	NMe	H	Me	4-хлорофенил	
2.45	NMe	Me	Me	4-хлорофенил	2.08/2.13
2.46	O	Me	Me	фенил	89-90°C
2.47	O	Me	Δ	фенил	
2.48	O	Me	Me	бензил	
2.49	O	Me	Me	Et	
2.50	O	H	Me	Et	
2.51	O	Δ	Me	Et	

31.07.98

- 45 -

Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
2.52	O	Me	Δ	Et	
2.53	O	Me	H	Et	
2.54	O	H	Me	метоксиметил	
2.55	O	Me	Me	метоксиметил	87-88°C
2.56	O	Me	Δ	метоксиметил	
2.57	O	Δ	Me	метоксиметил	
2.58	O	Me	Me	етоксиметил	
2.59	O	H	Me	цианометил	
2.60	O	Me	Me	цианометил	94-95°C
2.61	O	Δ	Me	цианометил	
2.62	-	Me	Me	азепино	
2.63	-	Me	Me	пиперидино	
2.64	-	Me	Me	пиролидино	
2.65	O	H	Me	t-бутил	
2.66	O	Me	Me	t-бутил	1.93/2.02
2.67	O	Me	Me	пропартил	120-122°C
1.68	O	Δ	Me	пропартил	
2.69	O	Me	Δ	пропартил	
2.70	O	Me	Me	2,2-дихлоро- циклопропилметил	1.99/1.99
2.71	O	Δ	Me	2,2-дихлоро- циклопропилметил	
2.72	O	H	Me	H	
2.73	O	Me	Me	H	114-116°C
2.74	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂	52-53°C
2.75	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂	
2.76	O	Me	H	CF ₃ CH ₂	
2.77	O	Me	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂	

Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
2.78	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
2.79	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	86°C
2.80	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
2.81	NMe	Me	Me	Me	80-81°C
2.82	NMe	Me	Δ	Me	
2.83	O	Me	Me	CH ₂ -CCl=CH ₂	66°C
2.84	O	Δ	Me	CH ₂ -CCl=CH ₂	
2.85	O	Me	Me	пропил	
2.86	O	Me	Me	бутил	58-62°C
2.87	O	Me	Me	гексил	50-53°C
2.88	O	Me	Me	метоксикарбонил- метил	1.96/2.04
2.89	O	H	Me	метоксикарбонил- метил	
2.90	O	Me	Me	3-флуоробензил	
2.91	O	Me	Me	4-хлоробензил	
2.92	O	Me	Me	2-хлоробензил	
2.93	O	Me	Me	2-CF ₃ -бензил	
2.94	O	Me	Me	3-CF ₃ -бензил	87-88°C
2.95	O	Me	Me	4-CF ₃ -бензил	
2.96	O	Me	Me	3,4-дихлоробензил	
2.97	O	Me	Me	2,4,6-триметилбензил	
2.98	O	Me	Me	4-хлоро-2-нитробензил	
2.99	O	Me	Me	3-метоксибензил	
2.100	O	Me	Me	2-фенетил	
2.101	O	Me	Me	3-фенилпропил	
2.102	O	Me	Me	2-(4-нитрофенил)етил	
2.103	O	Me	Me	2-(2-CF ₃ -фенил)етил	

31.07.98

- 47 -

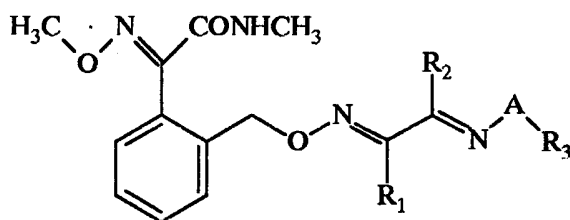
Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
2.104	O	Me	Me	2-(4-метоксифенил)етил	
2.105	O	Me	Me	2-хлоро-6-флуоробензил	
2.106	O	Me	Me	3,4-метилендиоксибензил	
2.107	O	Me	Me	2-цианобензил	
2.108	O	Me	Me	2-(4-хлорофенил)етил	
2.109	O	Me	Me	циклопропилметил	1.98/1.98
2.110	O	Me	Me	2-(1,3-диоксоланил)метил	
2.111	O	Me	Me	2,2,3,3-тетрафлуоро- циклобутилметил	
2.112	O	Me	Me	α-флуороетоксид- карбонилметил	
2.113	O	Me	2-тиенил	Me	83-86°C
2.114	O	Me	4-метил- фенил	Et	94-96°C
2.115	NMe	Me	4-метил- фенил	Me	
2.116	O	Me	Me	CH ₂ FCH ₂	62-63°C
2.117	O	Me	Me	2-(4-морфолино)етил	1.97/1.99
2.118	-	Me	Me	1-пирил	
2.119	O	Me	Me	2-(1-пиперидино)етил	1.95/2.00
2.120	O	Me	Me	2-флуоробензил	81-83°C
2.121	O	Me	Me	4-флуоробензил	116-118°C

** температура на топене или ¹H ЯМР на R₁/R₂ или R₃

31.07.98

- 48 -

Таблица 3



Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
3.1	NMe	Me	Me	6-CF ₃ -2-пиридил	2.07/2.15
3.2	NMe	H	Me	6-CF ₃ -2-пиридил	
3.3	NMe	Me	Δ	6-CF ₃ -2-пиридил	
3.4	NMe	Me	H	фенил	
3.5	NMe	Me	Me	фенил	
3.6	NMe	Δ	Me	фенил	
3.7	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -2-пиридил	
3.8	NMe	H	Me	4-CF ₃ -2-пиридил	
3.9	NMe	Δ	Δ	фенил	
3.10	NMe	Me	Me	5-CF ₃ -2-пиридил	
3.11	NMe	H	Me	5-CF ₃ -2-пиридил	135-136°C
3.12	-	H	Me	4-(1,2,4-триазаолил)	
3.13	-	Me	Me	4-(1,2,4-триазаолил)	
3.14	-	Me	Δ	4-(1,2,4-триазаолил)	
3.15	-	Me	Δ	4-морфолинил	
3.16	-	Me	Me	4-морфолинил	
3.17	-	H	Me	4-морфолинил	
3.18	NPh	H	Me	фенил	
3.19	NPh	Me	Me	фенил	
3.20	NPh	Me	Δ	фенил	
3.21	NPh	Δ	Me	фенил	
3.22	NMe	Me	Me	2-нитрофенил	
3.23	NMe	H	Me	2-нитрофенил	

Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
3.24	O	Me	Me	Me	90-92°C
3.25	O	H	Me	Me	1.97/7.68
3.26	O	Δ	Me	Me	1.94/1.95
3.27	O	Me	Δ	Me	88-90°C
3.28	O	Me	H	Me	
3.29	NMe	H	Me	3-CF ₃ -2-пиридил	
3.30	NMe	Me	Me	3-CF ₃ -2-пиридил	
3.31	NMe	Δ	Me	3-CF ₃ -2-пиридил	
3.32	NMe	Δ	Me	3-нитро-2-пиридил	
3.33	NMe	H	Me	3-нитро-2-пиридил	
3.34	NMe	Me	Me	3-нитро-2-пиридил	
3.35	NMe	Me	Me	2-CF ₃ -фенил	
3.36	NMe	Me	Δ	2-CF ₃ -фенил	
3.37	NMe	H	Me	2-CF ₃ -фенил	
3.38	NMe	Me	Me	3-CF ₃ -фенил	
3.39	NMe	Me	Δ	3-CF ₃ -фенил	
3.40	NMe	H	Me	4-CF ₃ -фенил	
3.41	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -фенил	
3.42	NMe	Me	Me	2-хлорофенил	1.72/2.11
3.43	NMe	Me	Me	3-хлорофенил	2.09/2.14
3.44	NMe	H	Me	4-хлорофенил	
3.45	NMe	Me	Me	4-хлорофенил	2.08/2.13
3.46	O	Me	Me	фенил	
3.47	O	Me	Δ	фенил	
3.48	O	Me	Me	бензил	
3.49	O	Me	Me	Et	
3.50	O	H	Me	Et	
3.51	O	Δ	Me	Et	

31.07.98

- 50 -

Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
3.52	O	Me	Δ	Et	
3.53	O	Me	H	Et	
3.54	O	H	Me	метоксиметил	
3.55	O	Me	Me	метоксиметил	2.00/2.03
3.56	O	Me	Δ	метоксиметил	
3.57	O	Δ	Me	метоксиметил	
3.58	O	Me	Me	етоксиметил	
3.59	O	H	Me	цианометил	
3.60	O	Me	Me	цианометил	2.00/2.01
3.61	O	Δ	Me	цианометил	
3.62	-	Me	Me	азепино	
3.63	-	Me	Me	пиперидино	
3.64	-	Me	Me	пиролуидино	
3.65	O	H	Me	t-бутил	
3.66	O	Me	Me	t-бутил	1.95/2.01
3.67	O	Me	Me	пропаргил	114-115°C
1.68	O	Δ	Me	пропаргил	
3.69	O	Me	Δ	пропаргил	
3.70	O	Me	Me	2,2-дихлоро- циклопропилметил	
3.71	O	Δ	Me	2,2-дихлоро- циклопропилметил	
3.72	O	H	Me	H	
3.73	O	Me	Me	H	
3.74	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂	94-96°C
3.75	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂	
3.76	O	Me	H	CF ₃ CH ₂	
3.77	O	Me	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂	

3107-98

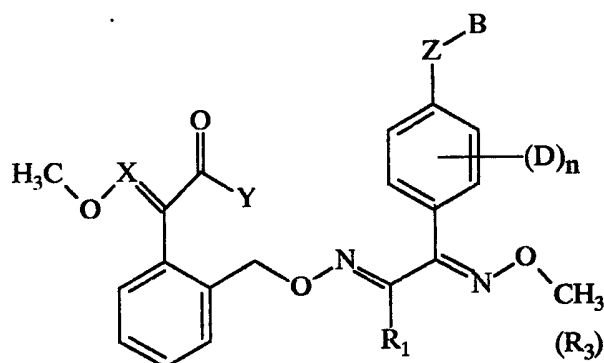
- 51 -

Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
3.78	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
3.79	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
3.80	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
3.81	NMe	Me	Me	Me	90-91°C
3.82	NMe	Me	Δ	Me	
3.83	O	Me	Me	CH ₂ -CCl=CH ₂	1.97/2.02
3.84	O	Δ	Me	CH ₂ -CCl=CH ₂	
3.85	O	Me	Me	пропил	
3.86	O	Me	Me	бутил	91-92°C
3.87	O	Me	Me	хексил	84-86°C
3.88	O	Me	Me	метилкарбамонил- метил	127-129°C
3.89	O	H	Me	метоксикарбонил- метил	
3.90	O	Me	Me	3-флуоробензил	
3.91	O	Me	Me	4-хлоробензил	
3.92	O	Me	Me	2-хлоробензил	
3.93	O	Me	Me	2-CF ₃ -бензил	
3.94	O	Me	Me	3-CF ₃ -бензил	1.96/2.00
3.95	O	Me	Me	4-CF ₃ -бензил	
3.96	O	Me	Me	3,4-дихлоробензил	
3.97	O	Me	Me	2,4,6-триметилбензил	
3.98	O	Me	Me	4-хлоро-2-нитробензил	
3.99	O	Me	Me	3-метоксибензил	
3.100	O	Me	Me	2-фенетил	
3.101	O	Me	Me	3-фенилпропил	
3.102	O	Me	Me	2-(4-нитрофенил)етил	
3.103	O	Me	Me	2-(2-CF ₃ -фенил)етил	

Пр. No.	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
3.104	O	Me	Me	2-(4-метоксифенил)етил	
3.105	O	Me	Me	2-хлоро-6-флуоробензил	
3.106	O	Me	Me	3,4-метилендиоксибензил	
3.107	O	Me	Me	2-цианобензил	
3.108	O	Me	Me	2-(4-хлорофенил)етил	
3.109	O	Me	Me	циклопропилметил	2.00/2.00
3.110	O	Me	Me	2-(1,3-диоксоланил)метил	
3.111	O	Me	Me	2,2,3,3-тетрафлуоро- циклобутилметил	
3.112	O	Me	Me	α -флуоретокси- карбонилметил	
3.113	O	Me	2-тиенил	Me	
3.114	O	Me	4-метил- фенил	Et	103-104°C
3.115	NMe	Me	4-метил- фенил	Me	
3.116	O	Me	Me	CH ₂ FCH ₂	95-97°C
3.117	O	Me	Me	2-(4-морфолино)етил	1.98/2.06
3.118	-	Me	Me	1-пирил	
3.119	O	Me	Me	2-(1-пиперидино)етил	1.96/1.98
3.120	O	Me	Me	2-флуоробензил-	90-91°C
3.121	O	Me	Me	4-флуоробензил	130-131°C

** температура на топене или ¹H ЯМР на R₁/R₂ или R₃

Таблица 4:



Пр.	A	Y	R ₁	Z*	n	B или D	Физични данни**
4.1	CH	OMe	Me	-	1	3-CF ₃	133-135°C
4.2	CH	OMe	Me	-	1	4-хлоро	140-142°C
4.3	CH	OMe	Me	-	1	3-хлоро	175-177°C
4.4	CH	OMe	Me	-	1	2-флуоро	136-137°C
4.5	CH	OMe	Me	-	1	4-метил	изомер1: 98-101°C изомер 2: масло изомер 3: масло
4.6	CH	OMe	Me	O	0	метил-	104-106°C
4.7	CH	OMe	Me	-	1	4-бромо	126-128°C
4.8	CH	OMe	Me	-	1	4-флуоро	141-144°C
4.9	CH	OMe	Me	-	2	3-F-5-CF ₃	164-166°C
4.10	CH	OMe	Me	-	0	-	141-143°C
4.11	CH	OMe	Me	-	1	2-метил	113-115°C
4.12	CH	OMe	Me	-	1	3-бромо	176-178°C
4.13	CH	OMe	Me	-	2	3,4-метил- лендиокси	143-145°C
4.14	CH	OMe	Me	O	0	алил-	77-80°C(изомер1) 2.08 (изомер2)
4.15	CH	OMe	SMe	-	1	4-метил	2.08 (изомер1) 2.11 (изомер2)
4.16	CH	OMe	Et	-	1	4-метил	3.90 (изомер1)

31.07.98

- 54 -

Пр.	A	Y	R ₁	Z*	n	В или D	Физични данни**
							3.97 (изомер2)
4.17	CH	OMe	Me	-	1	4-изобутил-	2.11 (изомер1)
							2.08 (изомер2)
4.18	CH	OMe	Me	O	0	пропартил-	2.06/2.11 (E/Z)
4.19	CH	OMe	Me	O	0	2,2,2-три-	2.11 (изомер1)
						флуороетил	2.07 (изомер2)
4.20	CH	OMe	Me	O	0	етил	93-95°C(изомер1)
							2.06 (изомер2)
4.21	CH	OMe	CN	-	1	4-метил	98-133°C (E/Z)
4.22	CH	OMe	CN	-	1	4-хлоро	106-108°C
4.23	CH	OMe	CN	-	2	3,4-дихлоро	128-130°C
							109/111°C (E/Z)
4.24	CH	OMe	CN	O	0	-CF ₃	масло (E/Z)
4.25	CH	OMe	CN	-	1	3-CF ₃	
4.26	CH	OMe	CN	-	1	2-хлоро	
4.27	CH	OMe	CN	-	1	4-флуоро	
4.28	CH	OMe	Me	O	0	фенил	112-114°C (изом1)
							масло (изомер 2)
4.29	CH	OMe	Me	O	0	-CH ₂ CH=CCl ₂	
4.30	CH	OMe	Me	O	0	-CH ₂ CH=CF ₂	
4.31	CH	OMe	Me	O	0	-CH ₂ CH=CBr ₂	
4.32	CH	OMe	Me	O	0	4-Cl-фенил	
4.33	CH	OMe	Me	O	0	4-F-фенил	
4.34	CH	OMe	Me	S	0	фенил	
4.35	CH	OMe	Me -CH ₂ O-	0	0	фенил***	изомер 1: смола
							изомер 2: смола
4.36	CH	OMe	Me -OCH ₂ -	0	0	фенил***	масло
4.37	N	OMe	Me	-	1	3-CF ₃	
4.38	N	OMe	Me	-	1	4-хлоро	

31.07.95

- 55 -

Пр.	A	Y	R ₁	Z*	n	В или D	Физични данни**
4.39	N	OMe	Me	-	1	3-хлоро	
4.40	N	OMe	Me	-	1	2-флуоро	111-112°C
4.41	N	OMe	Me	-	1	4-метил	101-103°C
4.42	N	OMe	Me	O	0	4-метил-	104-106°C
4.43	N	OMe	Me	-	1	4-бромо	134-136°C
4.44	N	OMe	Me	-	1	4-флуоро	
4.45	N	OMe	Me	-	2	3-F-5-CF ₃	
4.46	N	OMe	Me	-	0	-	
4.47	N	OMe	Me	-	1	2-метил	105-107°C
4.48	N	OMe	Me	-	1	3-бромо	
4.49	N	OMe	Me	-	2	3,4-метилендиокси	
4.50	N	OMe	Me	O	0	алил	74-76°C
4.51	N	OMe	SMe	-	1	4-метил	88-91°C
4.52	N	OMe	Et	-	1	4-метил	
4.53	N	OMe	Me	-	1	4-изобутил-	
4.54	N	OMe	Me	O	0	пропаргил	масло
4.55	N	OMe	Me	O	0	2,2,2-трифлуороетил	
4.56	N	OMe	Me	O	0	етил	масло
4.57	N	OMe	CN	-	1	4-метил	
4.58	N	OMe	CN	-	1	4-хлоро	
4.59	N	OMe	CN	-	2	3,4-дихлоро	
4.60	N	OMe	CN	O	0	-CF ₃	
4.61	N	OMe	CN	-	1	3-CF ₃	
4.62	N	OMe	CN	-	1	2-хлоро	
4.63	N	OMe	CN	-	1	4-флуоро	
4.64	N	OMe	Me	O	0	фенил	
4.65	N	OMe	Me	O	0	-CH ₂ CH=CCl ₂	
4.66	N	OMe	Me	O	0	-CH ₂ CH=CF ₂	
4.67	N	OMe	Me	O	0	-CH ₂ CH=CBr ₂	

31.07.95

- 56 -

Пр.	A	Y	R ₁	Z*	n	В или D	Физични данни**
4.68	N	OMe	Me	O	0	4-Cl-фенил	
4.69	N	OMe	Me	O	0	4-F-фенил	
4.70	N	OMe	Me	S	0	фенил	
4.71	N	OMe	Me	-CH ₂ O-	0	фенил***	
4.72	N	OMe	Me	-OCH ₂ -	0	фенил***	
4.73	N	NHCH ₃	Me	-	1	3-CF ₃	
4.74	N	NHCH ₃	Me	-	1	4-хлоро	
4.75	N	NHCH ₃	Me	-	1	3-хлоро	
4.76	N	NHCH ₃	Me	-	1	2-флуоро	2.11
4.77	N	NHCH ₃	Me	-	1	4-метил	2.10
4.78	N	NHCH ₃	Me	O	0	метил-	
4.79	N	NHCH ₃	Me	-	1	4-бромо	2.09
4.80	N	NHCH ₃	Me	-	1	4-флуоро	
4.81	N	NHCH ₃	Me	-	2	3-флуоро-5-CF ₃	
4.82	N	NHCH ₃	Me	-	0	-	
4.83	N	NHCH ₃	Me	-	1	2-метил	2.05
4.84	N	NHCH ₃	Me	-	1	3-бромо	
4.85	N	NHCH ₃	Me	-	2	3,4-метилендиокси	
4.86	N	NHCH ₃	Me	O	0	алил	118-120°C
4.87	N	NHCH ₃	SMe	-	1	4-метил	2.06
4.88	N	NHCH ₃	Et	-	1	4-метил	
4.89	N	NHCH ₃	Me	-	1	4-изобутил-	
4.90	N	NHCH ₃	Me	O	0	пропаргил	масло
4.91	N	NHCH ₃	Me	O	0	2,2,2-трифлуороетил	
4.92	N	NHCH ₃	Me	O	0	етил	масло
4.93	N	NHCH ₃	CN	-	1	4-метил	
4.94	N	NHCH ₃	CN	-	1	4-хлоро	
4.95	N	NHCH ₃	CN	-	2	3,4-дихлоро	
4.96	N	NHCH ₃	CN	O	0	-CF ₃	

31.07.98

- 57 -

Пр.	A	Y	R ₁	Z*	n	В или D	Физични данни**
4.97	N	NHCH ₃	CN	-	1	3-CF ₃	
4.98	N	NHCH ₃	CN	-	1	2-хлоро	
4.99	N	NHCH ₃	CN	-	1	4-флуоро	
4.100	N	NHCH ₃	Me	O	0	фенил	
4.101	N	NHCH ₃	Me	O	0	-CH ₂ CH=CCl ₂	
4.102	N	NHCH ₃	Me	O	0	-CH ₂ CH=CF ₂	
4.103	N	NHCH ₃	Me	O	0	-CH ₂ CH=CBr ₂	
4.104	N	NHCH ₃	Me	O	0	4-Cl-фенил	
4.105	N	NHCH ₃	Me	O	0	4-F-фенил	
4.106	N	NHCH ₃	Me	S	0	фенил	
4.107	N	NHCH ₃	Me -CH ₂ O-	0		фенил	***
4.108	N	NHCH ₃	Me -OCH ₂ -	0		фенил	***
4.109	CH	OCH ₃	Me	O	0	n-пропил	изомер 1: масло
							изомер 2: масло
4.110	CH	OCH ₃	Me	O	0	3,3-диметил-алил	107-110°C (изом 1)
							масло (изомер 2)
4.111	CH	OCH ₃	Me	O	0	2-метил-алил	изомер 1: 97-99°C
							изомер 2: масло
4.112	CH	OCH ₃	Me	O	0	3-метил-алил	изомер 1: масло
							изомер 2: масло
4.113	CH	OCH ₃	Me	O	0	алил	изомер 1: 74-76°C
4.114	CH	OCH ₃	Me	O	0	пропаргил	масло
4.115	CH	NHCH ₃	Me	O	0	алил	
4.116	CH	NHCH ₃	Me	O	0	пропаргил	
4.117	CH	OCH ₃	Me -OCH ₂ -	0		3-CF ₃ -фенил	изомер 1: 83-85°C
						***	изомер 2: смола
4.118	CH	OCH ₃	Me	O	0	3-CF ₃ -фенил	изомер 1: 127-128°
							изомер 2: масло
4.119	CH	OCH ₃	Me -OCH ₂ -	0		C ₆ H ₁₁ ***	изомер 1: масло

Пр.	A	Y	R ₁	Z*	n	B или D	Физични данни**
4.120	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	фенил***	изомер 2: масло изомер 1: масло
4.121	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	4-F-фенил ***	изомер 2: масло изомер 1: масло изомер 2: масло
4.122	CH	OCH ₃	Me	S	0	CH ₃	изомер 1: 119-121° изомер 2: смола
4.123	CH	OCH ₃	Me	-SO ₂ -	0	CH ₃	изомер 1: пiana изомер 2: смола
4.124	CH	OCH ₃	Me	-CH ₂ O-	0	фенил***	изомер 1: масло изомер 2: смола
4.125	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	4-CF ₃ -фенил***	
4.126	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	4-CBr-фенил***	
4.127	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	4-CH ₃ -фенил***	
4.128	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	4-OCH ₃ -фенил***	
4.129	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	2-CF ₃ -фенил***	
4.130	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	2-F-фенил***	изомер 1: масло изомер 2: масло
4.131	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	2-Cl-фенил***	
4.132	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	2-Br-фенил***	
4.133	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	3-F-фенил***	изомер 1: 111-112° изомер 2: масло
4.134	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	3-Cl-фенил***	изомер 1: масло изомер 2: масло
4.135	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	3-Br-фенил***	изомер 1: смола изомер 2: смола
4.136	N	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	алил***	
4.137	N	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	3-CF ₃ -фенил***	
4.138	N	NHCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	3-CF ₃ -фенил***	

Пр.	A	Y	R ₁	Z*	n	B или D	Физични данни**
4.139	N	OCH ₃	Me	-	1	2-CF ₃	масло
4.140	N	OCH ₃	Me	-	1	2-CH ₃	изомер 1: 105-107° изомер 2: смола
4.141	N	NHCH ₃	Me	-	1	2-CF ₃	смола
4.142	N	NHCH ₃	Me	-	1	2-CH ₃	изомер 1: масло изомер 2: масло
4.143	CH	OCH ₃	CN	-	-	H	масло
4.144	CH	OCH ₃	CN	O	0	CH ₃	изомер 1: 136-138° изомер 2: смола
4.145	CH	OCH ₃	CN	-	1	4- <i>t</i> -бутил	масло
4.146	CH	OCH ₃	CN	O	0	фенил	масло
4.147	CH	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHF ₂	изомер 1: 80-82°C
4.148	CH	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHCl ₂	
4.149	CH	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHBr ₂	
4.150	N	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHF ₂	
4.151	N	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHF ₂	
4.152	N	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHF ₂	
4.153	N	NHCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHF ₂	
4.154	N	NHCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHF ₂	
4.155	CH	OCH ₃	Me	-	1	4-етил	изомер 1: масло изомер 2: масло
4.156	CH	OCH ₃	Me	-	1	4- <i>t</i> -бутил	изомер 1: смола изомер 2: масло
4.157	CH	OCH ₃	Me	-	1	4-CF ₃	изомер 1: смола изомер 2: 101-102°
4.158	CH	OCH ₃	Me -OCH ₂ -	1		4-Cl-фенил***	
4.159	CH	OMe	CN	O	0	фенил	
4.160	N	OCH ₃	Me -SO ₂ -	0		Et'	пiana
4.161	N	NHCH ₃	Me -SO ₂ -	0		Et	141-143°C

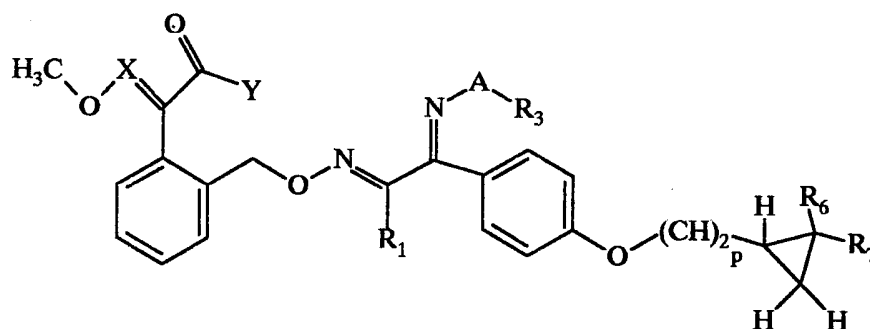
Пр.	A	Y	R ₁	Z*	n	B или D	Физични данни**
4.162	CH	OCH ₃	Me	-OCH ₂ -	0	SiMe ₃	изомер 1: смола изомер 2: масло
4.163	CH	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHFCI	изомер 1: 75-76°C
4.164	CH	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHFBr	изомер 1: смола
4.165	CH	OCH ₃	Me	O	0	CF ₂ CHFCF ₃	изомер 1: 82-84°C
4.166	CH	OCH ₃	Me	S	0	Et	изомер 1: масло изомер 2: масло
4.167	CH	OCH ₃	Me	S	0	n-C ₃ H ₇	изомер 1: масло изомер 2: масло
4.168	CH	OCH ₃	Me	-SCH ₂ -	0	3-CF ₃ -фенил	
4.169	CH	OCH ₃	Me	-SO ₂ CH ₂ -	0	3-CF ₃ -фенил	
						<u>B</u>	<u>D</u>
4.170	CH	OCH ₃	Me	-SO ₂ CH ₂ -	1	3-CF ₃ -фенил	3-F # #изом.1:112-114° #изомер 2:смола

* Означението "-" в колона Z означава, че съединението не притежава заместител -Z-B.

** Физични данни: температура на топене или ¹H ЯМР на R₁ или R₃, R₃ винаги е CH₃ в съответствие със структурната формула в началото на таблицата.

*** Радикалите Z трябва да се прочитат по такъв начин, че въглеродният скелет на структурата да бъде от лявата страна на въпросния елемент, докато заместителят B да е от дясната страна. Например, заместителят Z-B в съединението 4.107 е -CH₂O-фенил.

Таблица 5



Пр. No.	X	Y	A	R ₁	R ₃	R ₆	R ₇	p	Физични данни**
5.1	CH	OCH ₃	NMe	Me	Me	Cl	Cl	1	
5.2	CH	OCH ₃	NMe	H	Me	Cl	Cl	1	
5.3	CH	OCH ₃	NMe	Me	Me	F	F	1	
5.4	CH	OCH ₃	NMe	Me	Et	F	F	1	
5.5	CH	OCH ₃	NMe	Me	Me	Br	Br	1	
5.6	CH	OCH ₃	NPh	Me	Me	Cl	Cl	1	
5.7	CH	OCH ₃	NPh	H	Me	Cl	Cl	1	
5.8	CH	OCH ₃	NPh	Me	Et	Cl	Cl	1	
5.9	CH	OCH ₃	O	Me	Me	Cl	Cl	1	изомер 1: 86-88°C изомер 2: смола изомер 3: смола
5.10	CH	OCH ₃	O	H	Me	Cl	Cl	1	
5.11	CH	OCH ₃	O	Me	Me	F	F	1	
5.12	CH	OCH ₃	O	H	Me	F	F	1	
5.13	CH	OCH ₃	O	Me	H	F	F	1	
5.14	CH	OCH ₃	O	Me	C ₃ H ₇	Cl	Cl	1	
5.15	CH	OCH ₃	O	Me	Δ	Cl	Cl	1	
5.16	CH	OCH ₃	O	Δ	Me	Cl	Cl	1	
5.17	CH	OCH ₃	O	Me	Δ	Cl	Cl	1	
5.18	CH	OCH ₃	O	Me	Me	Br	Br	1	пена
5.19	CH	OCH ₃	O	H	Me	Br	Br	1	

31.07.98

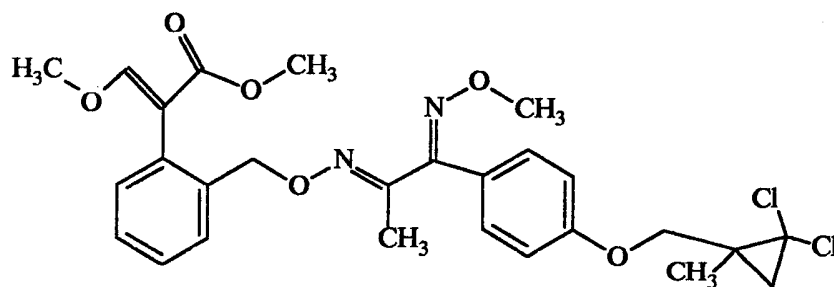
- 62 -

Пр. No.	X	Y	A	R ₁	R ₃	R ₆	R ₇	p	Фізичні данні**
5.20	CH	OCH ₃	O	Me	Me	Cl	Cl	2	
5.21	CH	OCH ₃	O	H	Me	Cl	Cl	2	
5.22	CH	OCH ₃	O	Me	Me	F	F	2	
5.23	N	OCH ₃	NMe	Me	Me	Cl	Cl	1	
5.24	N	OCH ₃	NMe	H	Me	Cl	Cl	1	
5.25	N	OCH ₃	NMe	Me	Me	F	F	1	
5.26	N	OCH ₃	NMe	Me	Et	F	F	1	
5.27	N	OCH ₃	NMe	Me		Br	Br	1	
5.28	N	OCH ₃	NPh	Me	Me	Cl	Cl	1	
5.29	N	OCH ₃	NPh	H	Me	Cl	Cl	1	
5.30	N	OCH ₃	NPh	Me	Et	Cl	Cl	1	
5.31	N	OCH ₃	O	Me	Me	Cl	Cl	1	
5.32	N	OCH ₃	O	H	Me	Cl	Cl	1	
5.33	N	OCH ₃	O	Me	Me	F	F	1	
5.34	N	OCH ₃	O	H	Me	F	F	1	
5.35	N	OCH ₃	O	Me	H	F	F	1	
5.36	N	OCH ₃	O	Me	C ₃ H ₇	Cl	Cl	1	
5.37	N	OCH ₃	O	Me	Δ	Cl	Cl	1	
5.38	N	OCH ₃	O	Δ	Me	Cl	Cl	1	
5.39	N	OCH ₃	O	Me	Δ	Cl	Cl	1	
5.40	N	OCH ₃	O	Me	Me	Br	Br	1	
5.41	N	OCH ₃	O	H	Me	Br	Br	1	
5.42	N	OCH ₃	O	Me	Me	Cl	Cl	2	
5.43	N	OCH ₃	O	H	Me	Cl	Cl	2	
5.44	N	OCH ₃	O	Me	Me	F	F	2	
5.45	N	NHCH ₃	NMe	Me	Me	Cl	Cl	1	
5.46	N	NHCH ₃	NMe	H	Me	Cl	Cl	1	
5.47	N	NHCH ₃	NMe	Me	Me	F	F	1	
5.48	N	NHCH ₃	NMe	Me	Et	F	F	1	

Пр. No.	X	Y	A	R ₁	R ₃	R ₆	R ₇	p	Физични данни**
5.49	N	NHCH ₃	NMe	Me		Br	Br	1	
5.50	CH	OCH ₃	O	Me	Me	H	H	1	изомер 1: масло изомер 2: масло
5.51	N	OCH ₃	O	Me	Me	Cl	Cl	1	изомер 1: масло
5.52	N	NHCH ₃	O	Me	Me	Cl	Cl	1	137-139°C
5.53	N	NHCH ₃	O	Me	Me	Cl	Cl	1	
5.54	N	NHCH ₃	O	H	Me	Cl	Cl	1	
5.55	N	NHCH ₃	O	Me	Me	F	F	1	
5.56	N	NHCH ₃	O	H	Me	F	F	1	
5.57	N	NHCH ₃	O	Me	H	F	F	1	
5.58	N	NHCH ₃	O	Me	Me	Cl	Cl	2	
5.59	N	NHCH ₃	O	H	Me	Cl	Cl	2	
5.60	N	NHCH ₃	O	Me	Me	F	F	2	

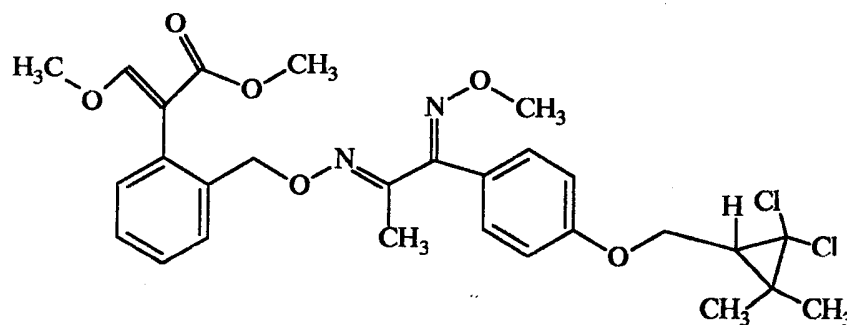
и съединенията

5.61



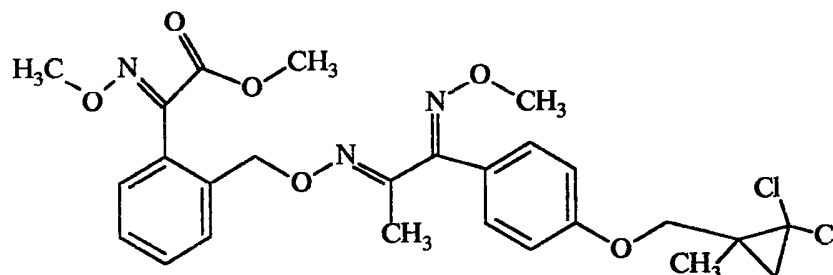
изомер 1: 113-115°C/ изомер 2: масло

5.62



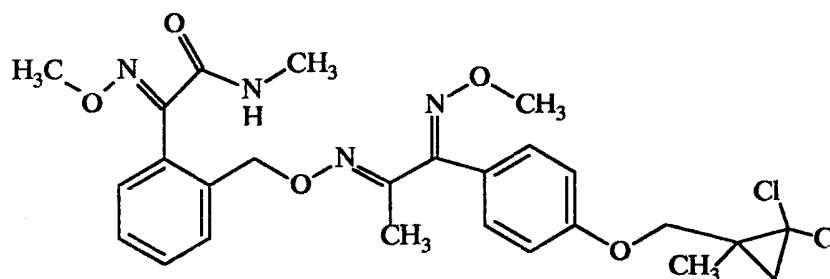
изомер 1: масло/ изомер 2: масло

5.63



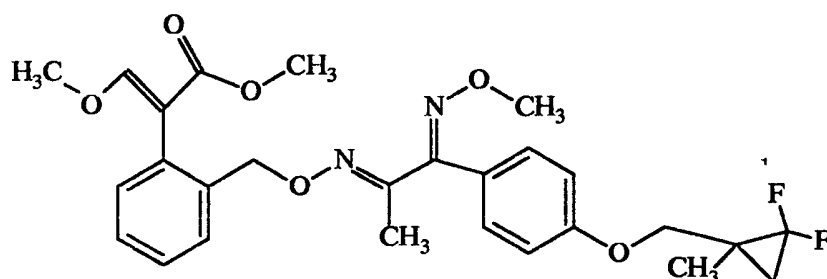
смола

5.64



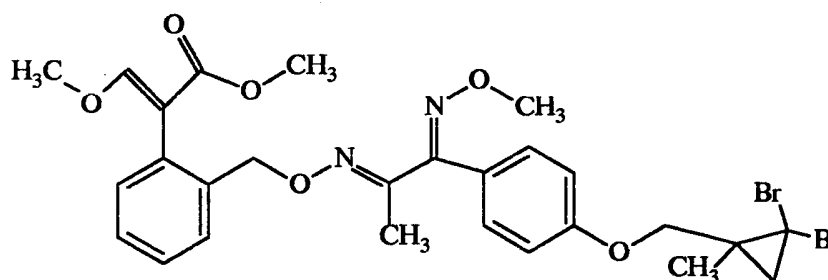
155-160°C

5.65



изомер 1: 109-110°C / изомер 2: смола

5.66



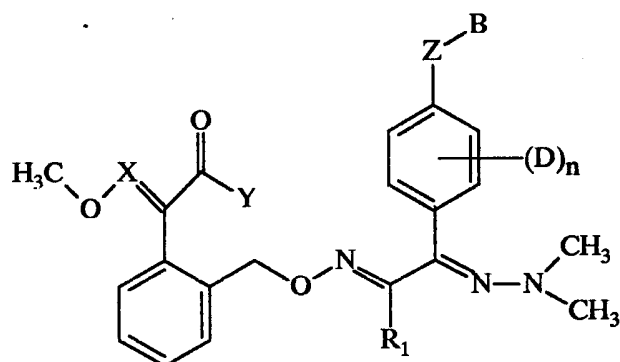
изомер 1: 131-133°C / изомер 2: смола

** Физични данни: температура на топене или ^1H ЯМР на R_1/R_2 или R_3

31.07.98

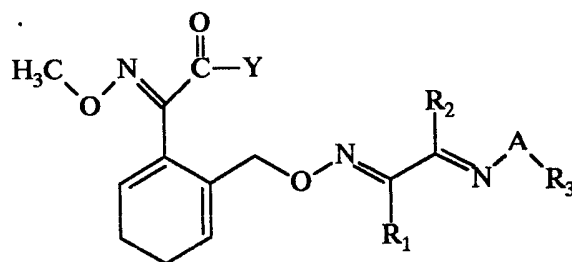
- 65 -

Таблица 6:



Пр.	A	Y	R ₁	Z*	n	B или D	Физични данни**
6.1	CH	OCH ₃	Me	O	0	алил	масло
6.2	CH	OCH ₃	Me	-	1	4-Br	изомер 1:масло изомер 2:масло
6.3	N	OCH ₃	Me	O	0	алил	масло
6.4	N	OCH ₃	Me	-	1	4-Br	131-132°C
6.5	N	NHCH ₃	Me	O	-	алил	масло
6.6	N	NHCH ₃	Me	-	1	4-Br	изомер 1:117-119° изомер 2:масло
6.7	CH	OCH ₃	Me	-	1	4-метил-	изомер 1: 2.10 изомер 1: 2.08
6.8	N	OCH ₃	Me	-	1	4-метил-	
6.9	N	NHCH ₃	Me	-	1	4-метил-	

Таблица 7:



Пр. No.	Y	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
7.1	OEt	NMe	Me	Me	Me	
7.2	OEt	NMe	H	Me	6-CF ₃ -2-пиридил	
7.3	OEt	NMe	Me	Δ	6-CF ₃ -2-пиридил	
7.4	OEt	NMe	Me	H	фенил	
7.5	OEt	NMe	Me	Me	фенил	
7.6	OEt	NMe	Δ	Me	фенил	
7.7	OEt	NMe	H	Me	4-морфолинил	
7.8	OEt	NPh	H	Me	фенил	
7.9	OEt	NPh	Me	Me	фенил	
7.10	OEt	NPh	Me	Δ	фенил	
7.11	OEt	NPh	Δ	Me	фенил	
7.12	OEt	O	Me	Me	Me	75°C
7.13	OEt	O	H	Me	Me	
7.14	OEt	O	Δ	Me	Me	
7.15	OEt	O	Me	Δ	Me	
7.16	OEt	O	Me	H	Me	
7.17	OEt	O	Me	Me	фенил	
7.18	OEt	O	Me	Me	бензил	
7.19	OEt	O	Me	Me	3-CF ₃ -2-пиридил	
7.20	OEt	O	Me	Me	3-CF ₃ -фенил	
7.21	NH ₂	NMe	Me	Δ	3-CF ₃ -фенил	
7.22	NH ₂	NMe	H	Me	4-CF ₃ -фенил	
7.23	NH ₂	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -фенил	

Пр. No.	Y	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
7.24	NH ₂	NMe	Me	Me	2-хлорофенил	
7.25	NH ₂	NMe	Me	Me	3-хлорофенил	
7.26	NH ₂	NMe	Me	Me	4-хлорофенил	
7.27	NH ₂	O	Me	Me	фенил	
7.28	NH ₂	O	Me	Me	Me	
7.29	NH ₂	O	Me	Me	бензил	
7.30	NH ₂	O	Me	Me	Et	
7.31	NH ₂	O	H	Me	Et	
7.32	NH ₂	O	Δ	Me	Et	
7.33	NH ₂	O	Me	Δ	Et	
7.34	NH ₂	O	Me	H	Et	
7.35	NH ₂	O	Me	Me	метоксиметил	
7.36	NH ₂	O	Me	Δ	метоксиметил	
7.37	NH ₂	O	Δ	Me	метоксиметил	
7.38	NH ₂	O	Me	Me	етоксиметил	
7.39	NH ₂	O	H	Me	пропаргил	
7.40	NH ₂	O	Me	Me	цианометил	
7.41	NH ₂	O	Me	Me	H	
7.42	NH ₂	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂	
7.43	NH ₂	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂	
7.44	NH ₂	O	Me	H	CF ₃ CH ₂	
7.45	NH ₂	O	Me	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
7.46	NH ₂	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
7.47	NH ₂	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
7.48	NH ₂	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
7.49	NHEt	NMe	Me	Δ	3-CF ₃ -фенил	
7.50	NHEt	NMe	H	Me	4-CF ₃ -фенил	
7.51	NHEt	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -фенил	

Пр. No.	Y	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Фізичні данні**
7.52	NHEt	NMe	Me	Me	2-хлорофеніл	
7.53	NHEt	NMe	Me	Me	3-хлорофеніл	
7.54	NHEt	NMe	Me	Me	4-хлорофеніл	
7.55	NHEt	O	Me	Me	феніл	
7.56	NHEt	O	Me	Me	Me	77°C
7.57	NHEt	O	Me	Me	бензил	
7.58	NHEt	O	Me	Me	Et	
7.59	NHEt	O	H	Me	Et	
7.60	NHEt	O	Δ	Me	Et	
7.61	NHEt	O	Me	Δ	Et	
7.62	NHEt	O	Me	H	Et	
7.63	NHEt	O	Me	Me	метоксиметил	
7.64	NHEt	O	Me	Δ	метоксиметил	
7.65	NHEt	O	Δ	Me	метоксиметил	
7.66	NHEt	O	Me	Me	етоксиметил	
7.67	NHEt	O	H	Me	пропартил	
7.68	NHEt	O	Me	Me	цианометил	
7.69	NHEt	O	Me	Me	H	
7.70	NHEt	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂	
7.71	NHEt	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂	
7.72	NHEt	O	Me	H	CF ₃ CH ₂	
7.73	NHEt	O	Me	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
7.74	NHEt	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
7.75	NHEt	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
7.76	NHEt	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
7.77	N(Me) ₂	NMe	Me	Δ	3-CF ₃ -феніл	
7.78	N(Me) ₂	NMe	H	Me	4-CF ₃ -феніл	
7.79	N(Me) ₂	NMe	Me	Me	4-CF ₃ -феніл	

31.07.98

- 69 -

Пр. No.	Y	A	R ₁	R ₂	R ₃ или NR ₃ R ₄	Физични данни**
7.80	N(Me) ₂	NMe	Me	Me	2-хлорофенил	
7.81	N(Me) ₂	NMe	Me	Me	3-хлорофенил	
7.82	N(Me) ₂	NMe	Me	Me	4-хлорофенил	
7.83	N(Me) ₂	O	Me	Me	фенил	
7.84	N(Me) ₂	O	Me	Me	Me	
7.85	N(Me) ₂	O	Me	Me	бензил	
7.86	N(Me) ₂	O	Me	Me	Et	
7.87	N(Me) ₂	O	H	Me	Et	
7.88	N(Me) ₂	O	Δ	Me	Et	
7.89	N(Me) ₂	O	Me	Δ	Et	
7.90	N(Me) ₂	O	Me	H	Et	
7.91	N(Me) ₂	O	Me	Me	метоксиметил	
7.92	N(Me) ₂	O	Me	Δ	метоксиметил	
7.93	N(Me) ₂	O	Δ	Me	метоксиметил	
7.94	N(Me) ₂	O	Me	Me	етоксиметил	
7.95	N(Me) ₂	O	H	Me	пропаргил	
7.96	N(Me) ₂	O	Me	Me	цианометил	
7.97	N(Me) ₂	O	Me	Me	H	
7.98	N(Me) ₂	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂	
7.99	N(Me) ₂	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂	
7.100	N(Me) ₂	O	Me	H	CF ₃ CH ₂	
7.101	N(Me) ₂	O	Me	H	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
7.102	N(Me) ₂	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂	
7.103	N(Me) ₂	O	Me	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
7.104	N(Me) ₂	O	Δ	Me	CF ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	

2. Примерни рецептури с активните съставки с формула I

(% = тегловни проценти)

2.1. Омокряеми прахове

Активна съставка от Таблица 1-7

a)

b)

c)

25%

50%

75%

31.07.98

- 70 -

Натриев лигносулфонат	5%	5%	-
Натриев лаурилсулфат	3%	-	5%
Натриев диизобутилнафтален- сулфонат	-	6%	10%
Октилфенол полиетиленгликол- етер (7-8 mol етилен оксиг)	-	2%	-
Високодисперсен силициев оксиг	5%	10%	10%
Каолин	62%	27%	-

Активната съставка се размесва щателно с добавките и сместа се смилва добре в подходяща мелница. В резултат на това се пжлучават омокряеми прякове, които могат да се разреждат с вода, така че да се получат суспензии с желаната концентрация.

2.2. Емулсионни концентрати

Активна съставка от Таблица 1-7	10%
Октилфенол полиетиленгликол етер (4-5 mol етиленоксиг)	3%
Калциев додецилбензенсулфонат	3%
Циклохексанон	34%
Ксиленова смес	50%

От този концентрат, чрез прибавяне на вода може да се получи емулсия с желаното разреждане.

2.3. Фини пракове (пудри)

	a)	b)
Активна съставка от Таблица 1-7	5%	8%
Талк	95%	-
Каолин	-	92%

Чрез смесване на активната съставка с носителя и смилане на сместа в подходяща мелница се получава готови за използване пудри.

2.4. Екструдирани гранули

Активна съставка от Таблица 1-7	10%
---------------------------------	-----

31.07.98

- 71 -

Натриев лигносулфат	2%
Карбоксиметилцелулоза	1%
Каолин	87%

Активната съставка се смесва с добавките и сместа се смила и омокря с вода. Тази смес се екструдира и впоследствие се изсушава във въздушен поток.

2.5. Покрити гранули

Активна съставка от Таблица 1-7	3%
Полиетиленгликол (MW 200)	3%
Каолин	94%
(MW = молекулно тегло)	

Фино смляната активна съставка се прибавя равномерно в смесител към омокрен с полиетиленгликол каолин. При това се получават свободни от фин прах покрити гранули.

2.6. Суспензионен концентрат

Активна съставка от Таблица 1-7	40%
Етиленгликол	10%
Нонилфенол полиетиленгликол етер	6%
(15 mol етиленоксиг)	
Натриев лигносулфонат	10%
Карбоксиметилцелулоза	1%
37% воден разтвор на формалдехид	0.2%
Силиконово масло под формата на	
75% водна емулсия	0.8%
Вода	32%

Фино смляната активна съставка се смесва щателно с добавките. Получава се суспензионен концентрат, от който чрез прибавяне на вода могат да се получат суспензии с желаното разреждане.

3. Биологични примери

А) Бактерицидно действие

Пример В-1: Действие срещу *Phytophthora infestans* при домати

а) Лечебно действие

Доматени растения, сорт "Roter Gnom", са отгледани в продължение на 3 седмици, след което са напръскани със суспензия на гъбична зооспора и инкубирани в климатична стая при температура от 18 до 20°C и с наситен с влага въздух. 24 часа по-късно овлажняването на въздуха е прекъснато. Когато изсъхнат, растенията се напръскват със смес, състояща се от активна съставка, преработена под формата на омокряем прах, при концентрация 200 ppm. След изсъхване на нанесеното покритие растенията са върнати в наситената с влага камера за 4 дни. Броят и размерът на типичните петна по листата, получени след този период от време, са използвани за оценка на активността на изпитваните вещества.

б) Предпазно-системно действие

Активната съставка, преработена под формата на омокряем прах, е нанесена при концентрация 60 ppm (по отношение на обема на почвата) върху повърхността на почвата на триседмични домати растения, сорт "Roter Gnom", отгледани в саксии. Растенията са оставени да престоят три дни, след което долната повърхност на листата им е напръскана със суспензия от зооспора на *Phytophthora infestans*. Така обработените растения са държани 5 дни в климатична стая при температура 18 до 20°C и наситен с влага въздух. Броят и размерът на типичните петна по листата, получени след този период от време, са използвани за оценка на активността на изпитваните вещества.

Докаато необработените, но заразени контролни растения показват 100% атакуване от паразитите, активните съставки с

формула I, съответстващи на някои от посочените в таблиците съединения, и по-специално на съединения No. 1.5, 1.24, 1.117, 2.24, 2.74 и 3.24, и в двата случая дават възможност атакуването да бъде намалено до 20% или по-малко.

Пример В-2: Действие срещу *Plasmopara viticola* (Bert. et Curt.)
(Berl. et De Toni) при лози

а) Остатъчно-предпазно действие

В оранжерия са отгледани малки лозови растения, сорт "Chasselas". При достигане на 10-листнен стадий 3 от растенията са напръскани със смес (200 ppm активна съставка). След изсъхване на покритието върху растенията, долната повърхност на листата им е заразена със суспензия на гъбична зооспора. Така обработените растения са държани 8 дни в наситена с влага камера. След този период симптомите на боледуване при контролните растения са ясно проявени. Броят и размерът на увредените места по обработените растения са използвани за оценка на активността на изпитваните вещества.

б) Лечебно действие

В оранжерия са отгледани малки лозови растения, сорт "Chasselas". При достигане на 10-листнен стадий долната повърхност на листата е заразена със суспензия от зооспора на *Plasmopara viticola*. След престояване 24 часа в наситена с влага климатична стая, растенията са напръскани със смес, съдържаща активна съставка (200 ppm активна съставка). Така обработените растения са държани още 7 дни в наситената с влага стая. След този период симптомите на боледуване при контролните растения са ясно проявени. Броят и размерът на увредените места по обработените растения са използвани за оценка на активността на изпитваните вещества.

В сравнение с контролните растения, увреждането на

растенията, обработени с активни съставки с формула I е 20% и по-малко.

Пример В-3: Действие срещу *Pythium debaryanum* при захарно цвекло (*Beta vulgaris*)

а) Действие след нанасяне върху почвата

Гъбите са развъдени върху стерилни овесени зърна и прибавени към смес от почва и пясък. Така заразената почва е поставена в цветни саксии и в тях са посадени семена на захарно цвекло. Непосредствено след посаждането на семената изпитваните съединения, преработени под формата на омокряеми прахове, са нанесени върху почвата под формата на водна суспензия (20 ррт активна съставка по отношение на почвения обем). След това саксиите са оставени в оранжерия в продължение на 2-3 седмици при температура 20-24°C. През цялото време, чрез леко напръскване с вода е поддържана равномерна влажност на почвата. При оценяването на резултата е определено поникването на растенията и съотношението между здравите и увредените растения.

б) Действие след обработка на семената

Гъбите са развъдени върху стерилни овесени зърна и прибавени към смес от почва и пясък. Така заразената почва е поставена в цветни саксии и в тях са посадени семена на захарно цвекло, обработени с изпитваните съединения, преработени под формата на прахове за обработка на семена (1000 ррт активна съставка по отношение на теглото на семената). След това саксиите с посадените в тях семена са оставени в оранжерия в продължение на 2-3 седмици при температура 20-24°C. Почвата е поддържана с равномерна влажност чрез леко напръскване с вода. При оценяването на резултата е определено поникването на растенията и съотношението между здравите и увредените

растения.

След обработката с активните съставки с формула I, и по-специално със съединения No. 1.5, 1.24, 1.117, 2.24, 2.74 и 3.24, над 80% от растенията израстват и имат здрав изглед. В контролните саксии израстват само няколко растения, които са с нездрав вид.

Пример В-4: Остатъчно-защитно действие срещу *Cercospora arachidicola* при фъстъци

Фъстъчени растения с височина 10-15 cm са напръскани с водна смес за пръскане (0.02% активна съставка) до протичане на сместа и 48 часа по-късно са заразени с гъбична конидиална суспензия. Растенията са инкубирани 72 часа при 21°C и висока атмосферна влажност, след което са оставени в оранжерия, докато се проявят типичните петна по листата. Въздействието на активната съставка е оценено 12 дни след заразяването въз основа на броя и размера на петната по листата.

Активните съставки с формула I предизвикват намаление на петната по листата до по-малко от 10% от листната повърхност. В някои случаи увреждането е изцяло намалено (0-5% атакуване).

Пример В-5: Действие срещу *Rhizinia graminis* при пшеница

а) Остатъчно-защитно действие

6 дни след засяването житните растения са напръскани с водна смес за пръскане (0.02% активна съставка) до протичане на сместа и 24 часа по-късно са заразени с гъбична уреидоспорна суспензия. След 48 часа инкубационен период (условия: относителна влажност 95% до 100% при 20°C) растенията са поставени в оранжерия при температура 22°C. 12 дни след заразяването е оценено развиването на ръждиви струпеи.

б) Системно действие

5 дни след засяването, в близост до житните растения е полята водна смес, предназначена за пръскане (0.006% активна съставка по отношение на обема на почвата). Внимателно е избегнат всеки контакт на течната смес с надпочвените части на растенията. 48 часа по-късно растенията са заразени с гъбична уреидоспорна суспензия. След 48 часа инкубационен период (условия: относителна влажност 95% до 100% при 20°C) растенията са поставени в оранжерия при температура 22°C. 12 дни след заразяването е оценено развиването на ръждиви струпеи.

Съединенията с формула I, по-точно тези от Таблица 1 и по-специално съединенията No. 1.5, 1.24, 1.117 и 2.24 предизвикват забележимо намаление на развъждането на гъби, в някои случаи до 10-0%.

Пример В-6: Действие срещу *Pyricularia oryzae* при ориз

а) Остатъчно-защитно действие

Оризови растения са отгледани в продължение на две седмици, след което са напръскани с водна смес за пръскане (0.02% активна съставка) до протичане на сместа и 48 часа по-късно са заразени с гъбична конидиална суспензия. Развъждането на гъбите е оценено 5 дни след заразяването, през което време относителната влажност е поддържана от 95% до 100%, а температурата 22°C).

б) Системно действие

Водна смес, предназначена за пръскане (0.006% активна съставка по отношение на обема на почвата) е полята в близост до двуседмични оризови растения. Внимателно е избегнат всеки контакт на течната смес с надпочвените части на растенията. След това в саксиите е налято такова количество вода, че най-ниските части на стъблата на оризовите растения да бъдат потопени във водата. След 96 часа растенията са заразени

с гъбична конидиална суспензия и държани 5 дни при относителна влажност от 95% до 100% и температура 24°C.

В много случаи съединенията с формула I предотвратяват развитието на болестта върху заразените растения.

Пример В-7: Остатъчно-защитно действие срещу *Venturia*

inaequalis при ябълки

Ябълкови калемки, които имат свежи филизи с дължина 10 до 20 см са напръскани със смес за пръскане (0.02% активна съставка) до протичане на сместа и 24 часа по-късно са заразени с гъбична конидиална суспензия. Растенията са инкубирани 5 дни при относителна влажност от 95% до 100% и държани още 10 дни при температура от 20 до 24°C. Увреждането от струпеи по кората е оценено 15 дни след заразяването.

Повечето от съединенията с формула I от Таблицы 1, 2 и 3 имат доказуемо действие срещу увреждането със струпеи.

Пример В-8: Действие срещу *Erysiphe graminis* при ечемик

а) Остатъчно-защитно действие

Ечемичени растения с височина приблизително 8 см са напръскани със смес за пръскане (0.02% активна съставка) до протичане на сместа и 3 до 4 часа по-късно са напращени с гъбична конидиална суспензия. Заразените растения са поставени в оранжерия при температура 22°C. Развъждането на гъбите е оценено 10 дни след заразяването.

б) Системно действие

В близост до ечемичени растения с височина приблизително 8 см е полята водна смес за пръскане (0.002% активна съставка по отношение на обема на почвата). Внимателно е избегнат всеки контакт на течната смес с надпочвените части на растенията. 48 часа по-късно растенията са напращени с гъбична конидиална суспензия. Заразените растения са поставени в оранжерия при

температура 22°C. Развъждането на гъбите е оценено 10 дни след заразяването.

Съединенията с формула I, и по-специално съединения No. 1.117, 2.24 и 3.24 общо взето са способни да намалят увреждането до по-малко от 20%, а в някои случаи и изцяло да го предотвратят.

Пример В-9: Действие срещу *Podosphaera leucotricha* при

ябълкови филизи

Ябълкови калемки, които имат свежи филизи с дължина около 15 cm, са напръскани със смес за пръскане (0.06% активна съставка). 24 часа по-късно обработените растения са заразени с гъбична конидиална суспензия и са поставени в стая с контролирани климатични условия при относителна влажност 70% и температура 20°C. Развъждането на гъбичките е оценено 12 дни след заразяването.

Активните съставки с формула I дават възможност за намаляване на увреждането до по-малко от 20%. Контролните растения показват 100% заболяемост.

Пример В-10: Действие срещу *Botrytis cinerea* при

ябълкови плодове. Остатъчно-защитно действие

Изкуствено наранени ябълки са обработени чрез нанасяне на капки от течност за пръскане върху наранените участъци. След това обработените плодове са заразени с гъбична спорова суспензия и са инкубирани една седмица при висока атмосферна влажност и температура около 20°C. Заключение за фунгицидното действие на изпитваното съединение е направено по броя на нараняванията, показващи признаци на загниване.

Активните съставки с формула I са в състояние да намалят разпространето на загниването, а в някои случаи да го спрат изцяло.

Пример В-11: Действие върху *Helminthosporium gramineum*

Житни зърна са замърсени със гъбична спорова суспензия и са оставени да изсъхнат. Замърсените зърна са обработени със суспензия от изпитваното вещество (600 ppm активна съставка по отношение на теглото на семената). След два дни зърната са поставени в подходящи блѳда, съдържащи агар, и след още четири дни е оценено развитието на гъбични колонии около семената. Изпитваните съединения са оценени на базата на броя и размера на гъбичните колонии.

В някои случаи съединенията с формула I показват добро въздействие, т.е. инхибиране на гъбичните колонии.

Пример В-12: Действие срещу Colletotrichum lagenarium при
краставици

Креставичените растения са отгледани в продължение на две седмици и тогава напрѳскани със смес за прѳскане (концентрация 0.002%). След 2 дни растенията са заразени с гъбична спорова суспензия (1.5×10^5 спори/ml) и са инкубирани в продължение на 36 часа при 23°C и висока атмосферна влажност. След това инкубацията е продължена при нормална атмосферна влажност и температура 22-23°C. Проявяването на развитието на гъбите е оценено 8 дни след заразяването. Необработените, но заразени контролни растения показват 100% атакуване от гъбите.

В някои случаи, със съединенията с формула 1, по-специално със съединения No. 1.5 и 3.24 се постига едно действително пълно инхибиране на развитието на болестта.

Пример В-13: Действие срещу Fusarium nivale при ръж

Ръж от сорта Tetrahell, естествено заразена с *Fusarium nivale* е обработена с изпитвания фунгицид, като е използван смесващ валяк, при следните концентрации: 20 или 6 ppm активна съставка (по отношение на теглото на семената).

Чрез използване на редосеялка заразеното и обработено семе

е засято през месец октомври на поле в участък от 3 m с 6 посежни бразди. Всяка концентрация е дублирана в по три бразди.

До оценяване на увреждането, изпитваните растения са отглеждани в нормални полеви условия (за предпочитане в район с цялостна снежна покривка през зимните месеци).

Фитотоксичността е оценена чрез отчитане на поникването на семето през есента и на броя растения на единица площ/броят прораствания на растение през пролетта.

За определяне ефективността на активната съставка е изчислен процентът на увредените от *Fusarium* растения непосредствено след стопяване на снега. В настоящия случай броят на увредените растения е по-малък от 5%. Израстналите растения имат здрав изглед.

Пример В-14: Действие срещу *Septoria nodorum* при пшеница

Пшеничени растения на 3-листнен стадий са напръскани със смес за пръскане (60 ppm активна съставка), получена с омокряем прах от активната съставка (2.8:1).

След 24 часа обработените растения са заразени с гъбична конидиална суспензия. Растенията са инкубирани 2 дни при относителна влажност 90-100% и са оставени в оранжерия при температура 20-24°C за още 10 дни. Развъждането на гъбите е оценено 13 дни след заразяването. Атакувани са под 1% от пшеничените растения.

Пример В-14: Действие срещу *Rhizoctonia solani* при ориз

Защитно-локално прилагане върху почвата

Почвата около десетдневни оризови растения е омокрена със суспензия (смес за пръскане), получена от изпитваното вещество, като е избегнат контактът на надпочвените части на растенията със суспензията. Три дни по-късно растенията са заразени, като във всяка саксия, между оризените растения, е поставена слама от

ечемичени стъбла, заразени с *Rhizoctonia solani*. След инкубиране в продължение на 6 дни в стая с контролирани климатични условия, при дневна температура 29°C и нощна температура 26°C и относителна влажност 95%, е оценено развъждането на гъбите. По-малко от 5% от растенията са поразени. Растенията имат здрав изглед.

Защитно-локално прилагане върху листата

12-дневни оризови растения са напръскани със суспензия, получена от изпитваните вещества. Един ден по-късно е извършено заразяване, като във всяка саксия, между оризените растения, е поставена слама от ечемичени стъбла, заразени с *Rhizoctonia solani*. Растенията са описани след инкубиране в продължение на 6 дни в стая с контролирани климатични условия, при дневна температура 29°C и нощна температура 26°C и относителна влажност 95%. Необработените, но заразени контролни растения показват 100% поразяване от гъбите. Съединенията с формула 1 в някои случаи предизвикват пълно инхибиране на болестта.

В. Инсектицидно действие

Пример В-16: Действие срещу *Aphis craccivora*

Грахов разсад е заселен с *Aphis craccivora* и впоследствие е напръскан със смес за пръскане, съдържаща 400 ppm активна съставка и инкубиран при 20°C. Процентното намаление на популацията (процентно действие) е определено след 3 и след 6 дни чрез сравняване на броя умрели афиди върху обработените и необработените растения.

При този опит съединенията от Таблица 1-7 показват добро въздействие. По-специално, съединение No. 4.5, изомер 1, има степен на въздействие над 80%.

Пример В-17: Действие върху *Diabrotica balteata*

Царевичен разсад е напръскан с водна емулсия за пръскане,

съдържаща 400 ppm активна съставка, и след изсъхване на нанесеното покритие е заселен с 10 личинки във втори стадий на развитие от *Diabrotica balteata* и поставен в пластмасов съд. Процентното намаление на популацията (процентно действие) е определено след 6 дни чрез сравняване на броя умрели личинки върху обработените и необработените растения.

При този опит съединенията от Таблица 1-7 показват добро въздействие. По-специално, съединения No. 1.5, 1.24, 2.24, 3.24, 4.5, изомер 1, 4.14, изомер 1, 4.117, двата изомера, 4.121, 4.170, 5.9, изомер 1 и 5.51, изомер 1, имат степен на въздействие над 80%.

Пример В-18: Действие срещу *Heliothis virescens*

Млади соеви растения са напръскани с водна емулсионна смес за пръскане, съдържаща 400 ppm активна съставка, и след изсъхване на нанесеното покритие са заселени с 10 гъсеници в начален стадий на развитие от *Heliothis virescens* и поставени в пластмасов съд. Процентното намаление на популацията и нарушеното хранене (процентно действие) е определено след 6 дни чрез сравняване на броя умрели гъсеници върху обработените и необработените растения.

При този опит съединенията от Таблица 1-7 показват добро въздействие. По-специално, съединения No. 4.5, изомер 1, 4.14, изомер 1, 4.18, 4.117, двата изомера, 4.121, 5.9, изомер 1 и 5.52, изомер 1, имат степен на въздействие над 80%.

Пример В-19: Действие срещу *Spodoptera littoralis*

Млади соеви растения са напръскани с водна емулсионна смес за пръскане, съдържаща 400 ppm активна съставка, и след изсъхване на нанесеното покритие са заселени с 10 гъсеници в трети стадий на развитие от *Spodoptera littoralis* и поставени в пластмасов съд. Процентното намаление на популацията и нарушеното хранене (процентно действие) е определено след 3 дни чрез сравняване на

боя умрели гъсеници върху обработените и необработените растения.

При този опит съединенията от Таблица 1-7 показват добро въздействие. По-специално, съединения No. 1.5, 1.24, 2.24, 3.24, 4.18, 4.5, изомер 1, 5.9, изомер 1 и 5.52, изомер 1, имат степен на въздействие над 80%.

С. Акарицидна активност

Пример В-20: Действие върху *Tetranychus urticae*

Млади бобени растения са заселени със смес от популация на *Tetranychus urticae* и впоследствие, един ден по-късно, са напръскани с водна емулсионна смес за пръскане, съдържаща 400 ppm активна съставка, след което са инкубирани 6 дни при 25°C и оценени. Процентното намаление на популацията и нарушеното хранене (процентно действие) е определено след 3 дни чрез сравняване на боя умрели яйца, личинки и гъсеници върху обработените и необработените растения.

При този опит съединенията от Таблица 1-6 показват добро въздействие. По-специално, съединения No. 1.5, 1.24, 2.24 и 3.24, 4.5, изомер 1, 4.14, изомер 1, 4.117, двата изомера, 5.9, изомер 1 и 5.52, изомер 1, имат степен на въздействие над 80%.

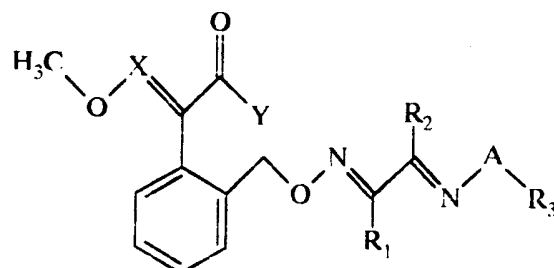
Пример В-21: Действие върху *Boophilus microplus*

Възрастни женски кърлежи, взети плътно един в друг, са прикрепени върху дъска от поливинилхлорид и са покрити с памучен тампон. Върху кърлежите са излети 10 ml от изпитвания воден разтвор, съдържащ 125 ppm активна съставка. Тампонът е отстранен и кърлежите са инкубирани 4 седмици за снасяне на яйцата си. При женските кърлежи действието на съединенията се проявява под формата на умъртвяване или стерилитет, а при яйцата - като действие, насочено срещу излюпването.

31.07.96

ПАТЕНТНИ ПРЕТЕНЦИИ

1. Съединение с формула I,



и до възможните негови изомери и изомерни смеси, в което или

- a) X е N-атом и
Y е OR_{11} или $N(R_{12})R_{13}$, или
- b) X е CH и
Y е OR_{11}

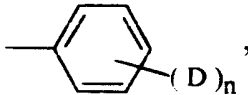
и в което освен това:

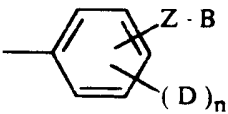
R_{11} е C_1 - C_4 алкил;

R_{12} и R_{13} означават поотделно водород или C_1 - C_4 алкил;

A е O-атом или групата NR_4 ;

R_1 е водород, C_1 - C_4 алкил, хало- C_1 - C_4 алкил, циклопропил, циано или метилтио;

R_2 е водород, C_1 - C_6 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, групата ,

групата  или тиенил;

D-радикалите са еднакви или различни и представляват халоген,

C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_2 халоалкил, C_1 - C_2 халоалкокси,

C_3 - C_6 алкенилокси, C_3 - C_6 алкинилокси, C_1 - C_4 алкилендиокси, циано или нитро;

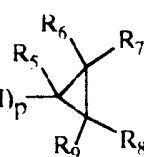
n е равно на 0, 1, 2, 3 или 4;

Z е -O-, -O-(C_1 - C_4 алкил)-, -(C_1 - C_4 алкил)-O-, -S(O)_m- (C₁-C₄алкил)-S(O)_m-, -S(O)_m-(C_1 - C_4 алкил)-,

m е равно на 0, 1 или 2,

В е C_1 - C_6 алкил, хало- C_1 - C_6 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил или е C_2 - C_6 алкенил, или C_2 - C_4 алкинил- C_1 - C_2 алкил, като всеки от радикалите е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми, или представлява арил или хетероциклил, като всеки от последните два радикала поотделно е незаместен или моно- до петзаместен с

C_1 - C_6 алкил, хало- C_1 - C_6 алкил, халоген, C_1 - C_6 алкокси, или

хало- C_1 - C_6 алкокси, или групата $-(CH)_p$ , или триметилсилил;

R_5 , R_6 , R_7 , R_8 и R_9 поотделно означават водород, C_1 - C_4 алкил или халоген, а

p е равно на 0, 1, 2 или 3;

R_3 е водород, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 халоалкил, съдържащ от 1 до 5 халогенни атоми, C_1 - C_4 алкокси- C_1 - C_2 алкил, C_2 - C_4 алкенил- C_1 - C_2 алкил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми,

C_2 - C_4 алкинил- C_1 - C_2 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, който е незаместен или заместен с 1 до 4 халогенни атоми, C_3 - C_6 циклоалкил- C_1 - C_4 алкил, който е незаместен или заместен с 1 до 4 халогенни атоми, циано- C_1 - C_4 -алкил, C_1 - C_4 алкоксикарбонил- C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_4 алкокси-карбамоил- C_1 - C_2 алкил, фенил- C_1 - C_3 алкил, който е незаместен или заместен с халоген, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 халоалкил, циано, нитро, или C_1 - C_4 алкилендиокси, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до тризаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или монозаместен до дигзаместен поотделно с C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, халоген,

C_1 - C_2 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, нитро или циано, или пиридил, който е незаместен или монозаместен до дигзаместен поотделно с C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, халоген,

C_1 - C_2 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, нитро или циано;

R_4 е C_1 - C_4 алкил, фенил или

R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, с който са свързани, образуват наситен или ненаситен 5- до 7-членен пръстен, който е незаместен или заместен с C_1 - C_4 алкил и който може да включва допълнително 1 до 3 хетероатоми, избрани измежду N, O и S,

с изключение на съединенията с формула I, в която

X е CH;

Y е OCH_3 ;

A е O-атом;

R_1 е водород и

R_3 е метил; тогава

R_2 е радикал, различен от фенил, който е заместен само с един или повече хлорни атоми.

2. Съединение с формула I съгласно претенция 1, в която или

a) X е N-атом и

Y е OCH_3 или $NHCH_3$, или

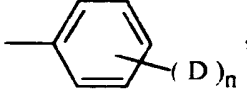
b) X е CH и

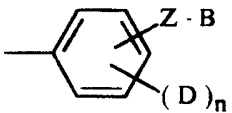
Y е OCH_3

и в която освен това

A е O-атом или групата NR_4 ;

R_1 е водород, C_1 - C_4 алкил, хало- C_1 - C_4 алкил, циклопропил, циано или метилтио;

R_2 е водород, C_1 - C_6 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, групата ,

групата  или тиенил;

D-радикалите са еднакви или различни и представляват халоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_2 халоалкил, C_1 - C_2 халоалкокси, C_3 - C_6 алкенилокси, C_3 - C_6 алкинилокси, C_1 - C_4 алкилендиокси; циано или нитро;

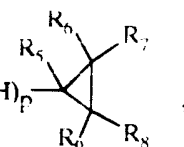
n е равно на 0, 1, 2, 3 или 4;

Z е $-O-$, $-O-(C_1-C_4\text{алкил})-$, $-(C_1-C_4\text{алкил})-O-$, $-S(O)_m-$, $-(C_1-C_4\text{алкил})-S(O)_m-$, $-S(O)_m-(C_1-C_4\text{алкил})-$,

m е равно на 0, 1 или 2,

V е $C_1-C_6\text{алкил}$, хало- $C_1-C_6\text{алкил}$, $C_3-C_6\text{циклоалкил}$, или е

$C_2-C_6\text{алкенил}$, или $C_2-C_4\text{алкинил}-C_1-C_2\text{алкил}$, като всеки от радикалите е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми, или е арил или хетероциклал, или арил или хетероциклал, като всеки от последните поотделно е незаместен или монозаместен до петзаместен с $C_1-C_6\text{алкил}$, хало- $C_1-C_6\text{алкил}$, халоген, $C_1-C_6\text{алкокси}$,

или хало- $C_1-C_6\text{алкокси}$, или групата $-(CH)_p$ ,

R_5 , R_6 , R_7 , R_8 и R_9 поотделно означават водород, $C_1-C_4\text{алкил}$ или халоген, и

p е 0, 1, 2 или 3;

R_3 е водород, $C_1-C_6\text{алкил}$, $C_1-C_6\text{халоалкил}$, съдържащ от 1 до 5 халогенни атоми, $C_1-C_4\text{алкокси}-C_1-C_2\text{алкил}$, $C_2-C_4\text{алкенил}-C_1-C_2\text{алкил}$, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми,

$C_2-C_4\text{алкинил}-C_1-C_2\text{алкил}$, $C_3-C_6\text{циклоалкил}$, който е незаместен или заместен с 1 до 4 халогенни атоми, $C_3-C_6\text{циклоалкил}-C_1-C_4\text{алкил}$, който е незаместен или заместен с 1 до 4 халогенни атоми, циано- $C_1-C_4\text{-алкил}$; $C_1-C_4\text{алкоксикарбонил}-C_1-C_2\text{алкил}$, фенил- $C_1-C_3\text{алкил}$, който е незаместен или заместен с халоген, $C_1-C_3\text{алкил}$,

$C_1-C_4\text{алкокси}$, $C_1-C_4\text{халоалкил}$, циано, нитро, или $C_1-C_4\text{алкилендиокси}$, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до тризаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или моно- до дигзаместен поотделно с $C_1-C_4\text{алкил}$,

$C_1-C_4\text{алкокси}$, халоген, $C_1-C_2\text{халоалкил}$, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, нитро или циано, или пиридил, който е

незаместен или моно- до дизаместен поотделно с C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, халоген, C_1 - C_2 халоалкил C_1 - C_2 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, нитро или циано;

R_4 е C_1 - C_4 алкил, фенил, или

R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, към който са присъединени, образуват наситен или ненаситен 5- до 7-членен пръстен, който е незаместен или заместен с C_1 - C_4 алкил и който може да включва допълнително 1 до 3 хетероатоми, избрани измежду N, O и S.

3. Съединение с формула I съгласно претенция 2, в което X е Nu

Y е OCH_3 .

4. Съединение с формула I съгласно претенция 2, в което X е CH .

5. Съединение с формула I съгласно претенция 2, в което X е N,

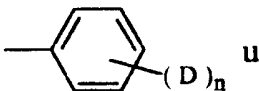
Y е $NHCH_3$ и

R_1 е H, CH_3 , циклопропил или CN.

6. Съединение с формула I съгласно претенция 2, в което A е кислород, NCH_3 или $p-C_6H_5$.

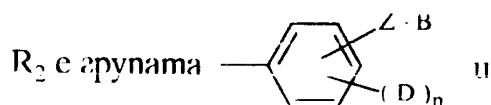
7. Съединение с формула I съгласно претенция 2, в което R_1 е водород, метил, циклопропил или циано.

8. Съединение с формула I съгласно претенция 2, в което R_1 е C_1 - C_4 алкил или циклопропил.

9. Съединение с формула I съгласно претенция 2, в което R_2 е групата  и

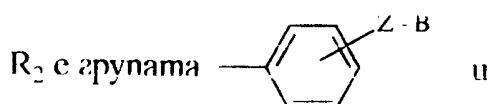
D е халоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_2 алкил, заместен с 1 до 5 халогенни атоми, C_1 - C_2 халоалкокси, C_3 - C_6 алкенилокси, C_3 - C_6 алкинил-окси, C_1 - C_4 алкилендиокси, циано, или нитро, или тиенил и n е равно на 0, 1, 2, 3 или 4.

10. Съединение с формула I съгласно претенция 2, в което



Z е -O-, -O-(C₁-C₄алкил)-, -(C₁-C₄алкил)-O-, -S(O)₂-(C₁-C₄алкил)-S(O)₂-, -S(O)₂-(C₁-C₄алкил)-.

11. Съединение с формула I съгласно претенция 2, в което



B е C₁-C₄алкил, халоген-C₁-C₄алкил, или C₂-C₄алкенил, или C₂-C₄алкинил-C₁-C₂алкил, всеки от които е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми, или е арил, или арил, който е монозаместен или дизаместен поотделно с C₁-C₂алкил, хало-C₁-C₂алкил, халоген,



R₅, R₆, R₇, R₈ и R₉ поотделно означават водород, C₁-C₄алкил или халоген и

p е 0, 1, 2 или 3;

12. Съединение с формула I съгласно претенция 2, в което

R_2 е фенилна група, заместена на 4-то място с Z-B.

13. Съединение с формула I съгласно претенция 2, в което

R₃ е водород, C₁-C₆алкил, C₁-C₄халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, C₁-C₂алкокси-C₁-C₂алкил, C₁-C₄алкоксикарбонил-C₁-C₂алкил, пропенил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми, пропаргил, C₃-C₆циклоалкил, циклопропилметил, незаместен или заместен с 1 до 2 халогенни атоми, циано-C₁-C₂алкил, фенил-C₁-C₂алкил, който е незаместен или заместен с халоген, метил, метокси или халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до дизаместена с еднакви или различни

заместители; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или пиридил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, към който са присъединени, образуват наситен или ненаситен 5- до 7-членен пръстен, който е незаместен или заместен с C_1 - C_4 алкил и който може да включва допълнително 1 до 3 хетероатоми, подбрани измежду N, O и S;

14. Съединение с формула I съгласно претенция 2, в което R_4 е метил или фенил.

15. Съединение с формула I съгласно претенция 1, в което
 X е CH ;
 Y е OCH_3 ;
 R_1 е CH_3 ;
 A е O-атом;
 R_2 е или 4-метилфенил, или 4-алилоксифенил, или 4-(3-трифлуорометилбензилокси)фенил, или 4-(2,2-дихлороциклопропил-метокси)-фенил и
 R_3 е CH_3 ;

16. Съединение с формула I съгласно претенция 1, в което
 а) X е N-атом и
 Y е OCH_3 или $NHCH_3$, или
 б) X е CH и
 Y е OCH_3
 и в което освен това

A е O-атом или групата NR_4 ;
 R_1 е водород; C_1 - C_4 алкил; циклопропил; циано или метилтио;
 R_2 е водород; C_1 - C_6 алкил; C_3 - C_6 циклоалкил; фенил, който е

незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_2 халоалкил, C_1 - C_2 халоалкокси, C_3 - C_6 алкенилокси, C_3 - C_6 алкинилокси, C_1 - C_4 алкилендиокси, циано или нитро; тиенил;

R_3 е водород; C_1 - C_6 алкил; C_1 - C_6 халоалкил, съдържащ от 1 до 5 халогенни атоми; C_1 - C_4 алкокси- C_1 - C_2 алкил; C_2 - C_4 алкенил- C_1 - C_2 алкил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми;

C_2 - C_4 алкинил- C_1 - C_2 алкил; C_3 - C_6 циклоалкил, който е незаместен или заместен с 1 до 4 халогенни атоми; C_3 - C_6 циклоалкил- C_1 - C_4 алкил, който е незаместен или заместен с 1 до 4 халогенни атоми; циано- C_1 - C_4 алкил; C_1 - C_4 алкоксикарбонил- C_1 - C_2 алкил; фенил- C_1 - C_3 алкил, който е незаместен или заместен с халоген, C_1 - C_3 алкил,

C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 халоалкил, циано, нитро, C_1 - C_4 алкилендиокси, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до тризаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с

C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, халоген, C_1 - C_2 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, нитро или циано; пиридил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с

C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, халоген, C_1 - C_2 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, нитро или циано;

R_4 е C_1 - C_4 алкил; фенил; или

R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, към който са присъединени, образуват наситен или ненаситен 5- до 7-членен пръстен, който е незаместен или заместен с C_1 - C_4 алкил и който може да включва допълнително 1 до 3 хетероатоми, избрани измежду N, O и S.

17. Съединение с формула I съгласно претенция 16, в което

X е CH или N

Y е OCH_3

A е O или N- R_4

R_1 е метил; циклопропил или метилтио;

R_2 е метил; циклопропил; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 алкокси, C_1-C_2 алкил, който е заместен с 1 до 5 халогенни атоми, C_1-C_2 халоалкокси, C_3-C_6 алкенилокси, C_3-C_6 алкинилокси, C_1-C_4 алкилендиокси, циано или нитро; или тиенил; и в който

R_3 е съгласно дефиницията за формула I и

R_4 е метил или фенил, или

R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, към който са присъединени, представляват пиролидин, пиперидин, морфолин, тиоморфолин, хексамтиленимин, имидазол, пиразол, пирол, 1,2,4-триазол или 1,2,3-триазол.

18. Съединение с формула I съгласно претенция 16, в което

X е N,

Y е $NHCH_3$,

A е O или $N-R_4$,

R_1 е метил, циклопропил или метилтио;

R_2 е метил; циклопропил; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, C_1-C_4 алкил,

C_1-C_4 алкокси, C_1-C_2 алкил, който е заместен с 1 до 5 халогенни атоми, C_1-C_2 халоалкокси, C_3-C_6 алкенилокси, C_3-C_6 алкинилокси,

C_1-C_4 алкилендиокси, циано или нитро; или тиенил; и в който

R_3 е съгласно дефиницията за формула I и

R_4 е метил или фенил, или

R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, към който са присъединени, представляват пиролидин, пиперидин, морфолин, тиоморфолин, хексамтиленимин, имидазол, пиразол, пирол, 1,2,4-триазол или 1,2,3-триазол.

19. Съединение с формула I съгласно претенция 16, в което

A е O-атом,

R_1 е метил,

R_2 е метил; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_2 алкил, който е заместен с 1 до 5 халогенни атоми, C_1 - C_2 халоалкокси, C_3 - C_6 алкенилокси, C_3 - C_6 алкинилокси, C_1 - C_4 алкилендиокси, циано или нитро; или тиенил; и

R_3 е C_1 - C_6 алкил.

20. Съединение с формула I съгласно претенция 16, в което

R_1 е метил,

R_2 е метил,

R_3 е съгласно описанието в претенция 1,

R_4 е метил или фенил, или

R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, към който са присъединени, образуват наситен или ненаситен 5- до 7-членен пръстен, който е незаместен или заместен с C_1 - C_4 алкил и който може да включва допълнително 1 до 3 хетероатоми, подбрани измежду N, O и S.

21. Съединение с формула I съгласно претенция 16, в което

R_3 е водород; C_1 - C_4 алкил; C_1 - C_4 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми; C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкил; пропенил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми; пропаргил;

C_3 - C_6 циклоалкил; C_3 - C_6 циклоалкилметил, който е незаместен или заместен с 1 до 2 халогенни атоми; циано- C_1 - C_2 алкил; C_1 - C_2 алкоксикарбонил- C_1 - C_2 алкил; фенил- C_1 - C_2 алкил, който е незаместен или заместен с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано, нитро или

C_1 - C_2 алкилендиокси, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до дизаместена поотделно с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или пиридил,

който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро;

R_4 е метил или фенил; или

R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, към който са присъединени, образуват наситен или ненаситен 5- до 7-членен пръстен, който е незаместен или заместен с C_1 - C_4 алкил и който може да включва допълнително 1 до 3 хетероатоми, избрани измежду N, O и S;

22. Съединение с формула I съгласно претенция 21, в което R_3 и R_4 , заедно с азотния атом, към който са присъединени, представляват триазолил, морфолинил, 2,6-диметилморфолинил, азепинил, пиперидил или пиролидинил.

23. Съединение с формула I съгласно претенция 16, в което
 A е O-атом,
 R_1 е метил,
 R_2 е метил; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_2 алкил, който е заместен с 1 до 5 халогенни атоми, C_1 - C_2 халоалкокси, C_3 - C_6 алкенилокси, C_3 - C_6 алкинилокси, C_1 - C_4 алкилендиокси, циано или нитро; или тиенил; или
 R_3 е водород; C_1 - C_4 алкил; C_1 - C_4 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми; C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкил; пропенил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми; пропаргил;
 C_3 - C_6 циклоалкил; C_3 - C_6 циклоалкилметил, който е незаместен или заместен с 1 до 2 халогенни атоми; циано- C_1 - C_2 алкил; C_1 - C_2 алкокси-карбонил- C_1 - C_2 алкил; фенил- C_1 - C_2 алкил, който е незаместен или заместен с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано, нитро или C_1 - C_2 алкилендиокси, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до дизаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или

монозаместен до гизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или пиридил, който е незаместен или монозаместен до гизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро;

24. Съединение с формула I съгласно претенция 23, в което

A е O-атом,

R₁ е метил,

R₂ е метил; фенил, който е незаместен или монозаместен до гизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, трифлуорометил или трифлуорометокси; и

R₃ е метил.

25. Съединение с формула I съгласно претенция 16, в което

A е NCH₃,

R₁ е метил,

R₂ е метил; фенил, който е незаместен или монозаместен до гизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, трифлуоро-метил или трифлуорометокси;

R₃ е метил; фенил, който е незаместен или монозаместен до гизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или пиридил, който е незаместен или монозаместен до гизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро.

26. Съединение с формула I съгласно претенция 1, в което

X е N-атом;

Y е OR₁₁;

R₁₁ е C₁-C₄алкил; и в което

A, R₁, R₂ и R₃ са съгласно дефиницията в претенция 1.

27. Съединение с формула I съгласно претенция 26, в което

A е O-атом;

R_1 и R_2 са метил;

R_3 е водород; C_1 - C_4 алкил; C_1 - C_4 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми; C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкил; пропенил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми; пропаргил;

C_3 - C_6 циклоалкил; C_3 - C_6 циклоалкилметил, който е незаместен или заместен с 1 до 2 халогенни атоми; циано- C_1 - C_2 алкил; C_1 - C_2 алкокси-карбонил- C_1 - C_2 алкил; фенил- C_1 - C_2 алкил, който е незаместен или заместен с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано, нитро или C_1 - C_2 алкилендиокси, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до дизаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или пиридил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро;

28. Съединение с формула I съгласно претенция 27, в което R_3 е водород; C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_4 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми.

29. Съединение с формула I съгласно претенция 1, в което

X е N-атом;

Y е $N(R_{12})R_{13}$;

R_{12} и R_{13} поотделно са водород или C_1 - C_4 алкил; и в което

A, R_1 , R_2 и R_3 са съгласно дефиницията в претенция 1.

30. Съединение с формула I съгласно претенция 29, в което

Y е NH_2 , $N(CH_3)_2$ или NHC_2H_5 ;

A е O-атом;

R_1 и R_2 са метил;

R_3 е водород; C_1 - C_4 алкил; C_1 - C_4 халоалкил, съдържащ от 1 до 3

халогенни атоми; C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкил; пропенил, който е незаместен или заместен с 1 до 3 халогенни атоми; пропаргил; C_3 - C_6 циклоалкил; C_3 - C_6 циклоалкилметил, който е незаместен или заместен с 1 до 2 халогенни атоми; циано- C_1 - C_2 алкил; C_1 - C_2 алкокси-карбонил- C_1 - C_2 алкил; фенил- C_1 - C_2 алкил, който е незаместен или заместен с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано, нитро или C_1 - C_2 алкилендиокси, като е възможно фенилната група да бъде монозаместена до дизаместена с еднакви или различни заместители; фенил, който е незаместен или монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро; или пиридил, който е незаместен, монозаместен до дизаместен поотделно с халоген, метил, метокси, халометил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми, циано или нитро;

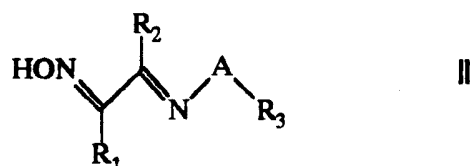
31. Съединение с формула I съгласно претенция 30, в което R_3 е водород; C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_4 халоалкил, съдържащ от 1 до 3 халогенни атоми.

32. Съединение с формула I съгласно претенция 1, в което двойната връзка $X=C$ е в E-форма.

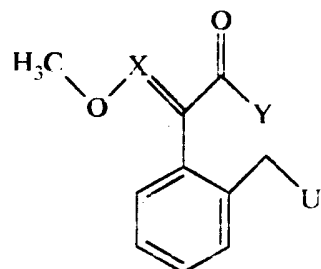
33. Метод за получаване на съединение с формула I съгласно претенция 1, характеризиращ се с това, че включва:

А) За получаване на съединение с формула I, в която Y е $N(R_{12})R_{13}$: взаимодействие на съединение с формула I, където Y е OR_{11} с $HN(R_{12})R_{13}$, в разтворител при температура от $0^\circ C$ до $40^\circ C$;

В) За получаване на съединение с формула I, в която X, Y, A и R_1 - R_3 са съгласно дефиницията за формула I (и в което R_3 не е водород): взаимодействие на оксим с обща формула II



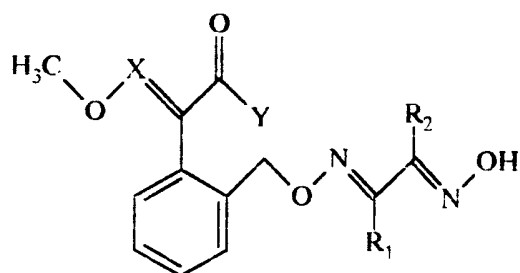
В която А и R_1-R_3 са съгласно даденото по-горе определение, с бензишно производно с обща формула



III

В която X и Y са съгласно даденото по-горе определение, а U е отцепваща се група, в инертен органичен разредител в присъствие или отсъствие на обръщащ фазите катализатор при температура от 0°C до 50°C.

C) За получаване на съединение с формула I, в която А е кислород, а X, Y и R_1-R_3 са съгласно дефиницията за формула I: взаимодействие на оксим с обща формула IV



IV

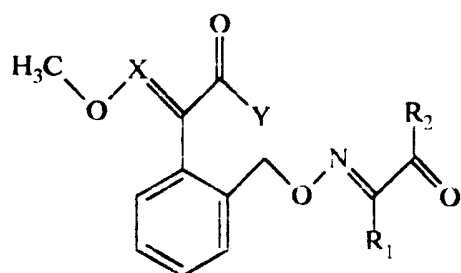
В която X, Y, R_1 и R_2 са съгласно даденото по-горе определение, със съединение с обща формула V

$U-R_3$

V,

като R_3 е съгласно дефиницията за формула I, а U - съгласно дефиницията за формула III (и R_3 не е нито водород, нито фенил, нито пиридил).

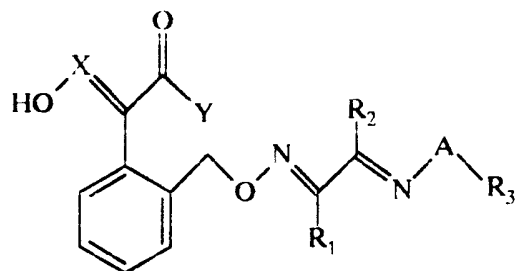
D) За получаване на съединение с формула IV, в която X, Y и R_1 и R_2 са съгласно дефиницията за формула I: взаимодействие на кетон с обща формула VI



VI

В която X, Y и R₁ и R₂ са съгласно даденото по-горе определение, с хидроксиламин или с негова сол в разтворител при 0°C до 50°C;

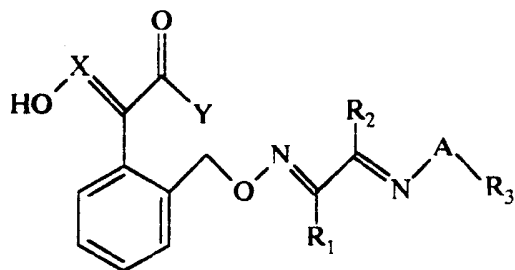
Е) За получаване на съединение с формула I, в която A, X, Y и R₁-R₃ са съгласно дефиницията за формула I (и в която R₃ не е водород): взаимодействие на енол или оксим с обща формула VII



VII

В която A, X, Y и R₁-R₃ са съгласно даденото по-горе определение, с метилиращ агент, например метилйодид, диметилсулфат или диазометан в присъствието на основа в подходящ разтворител.

34. Метод за получаване на съединение с формула VII,

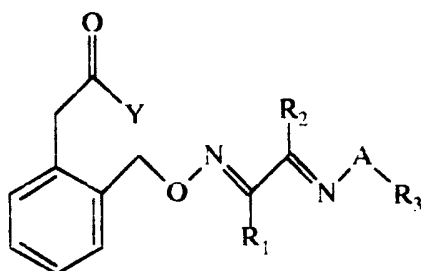


VII

В която A, X, Y и R₁-R₃ са съгласно дадената дефиниция за формула I, характеризиращ се с това, че включва:

А) За получаване на съединение с формула VII, в която X е CH: взаимодействие на производно на фенолоцетна киселина с формула VIII

31.07.95

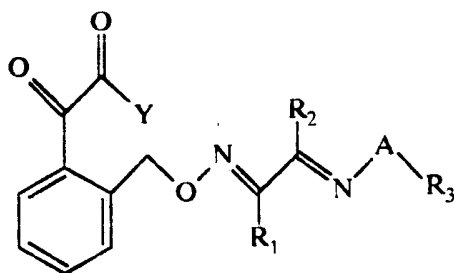


VIII

В която А, Y и R₁-R₃ са съгласно даденото по-горе определение, с формат в присъствието на основа;

В) За получаване на съединение с формула VII, в която X е N: взаимодействие на производно на фенилоцетна киселина с формула VIII в която А, Y и R₁-R₃ са съгласно даденото по-горе определение, с азотна киселина или нитрит в присъствие на основа;

С) За получаване на съединение с формула VII, в която X е CH: взаимодействие на кетоестер с формула IX



IX

В която А, Y и R₁ - R₃ са съгласно даденото по-горе определение, с метоксиметилентрифенилфосфоран;

Д) За получаване на съединение с формула VII, в която X е N: взаимодействие на кетоестер с формула IX, в която А, Y и R₁ - R₃ са съгласно даденото по-горе определение, с О-метилхидроксиламин или неговa сол.

35. Състав за контрол на паразити, характеризиращ се с това, че съдържа като активна съставка съединение съгласно претенция 1, заедно с подходящ носител.

36. Състав съгласно претенция 35, характеризиращ се с това, че съдържа като активна съставка съединение съгласно всяка една от претенции 2-15.

37. Състав съгласно претенция 35, характеризиращ се с това, че съдържа като активна съставка съединение съгласно всяка една от претенции 16-25.

38. Състав съгласно претенция 35, характеризиращ се с това, че съдържа като активна съставка съединение съгласно всяка една от претенции 26-32.

39. Състав съгласно всяка една от претенции 35-38, характеризиращ се с това, че паразитите са фитопатогенни микроорганизми.

40. Състав съгласно претенция 39, характеризиращ се с това, че микроорганизмите са гъби.

41. Състав съгласно всяка една от претенции 35-38, характеризиращ се с това, че паразитите са насекоми или Asarina.

42. Приложение на съединения с формула I съгласно претенция 1 за контрол на паразити.

43. Метод за контрол и предпазване от паразити, характеризиращ се с това, че се състои в прилагане на съединение съгласно претенция 1 към паразитите или в обкръжаващата ги среда.

44. Метод съгласно претенция 43, характеризиращ се с това, че се прилага съединение съгласно всяка една от претенции 2-15.

45. Метод съгласно претенция 43, характеризиращ се с това, че се прилага съединение съгласно всяка една от претенции 16-25.

46. Метод съгласно претенция 43, характеризиращ се с това, че се прилага съединение съгласно всяка една от претенции 26-32.

47. Метод съгласно всяка една от претенции 43-46, характеризиращ се с това, че паразитите са фитопатогенни

микроорганизми.

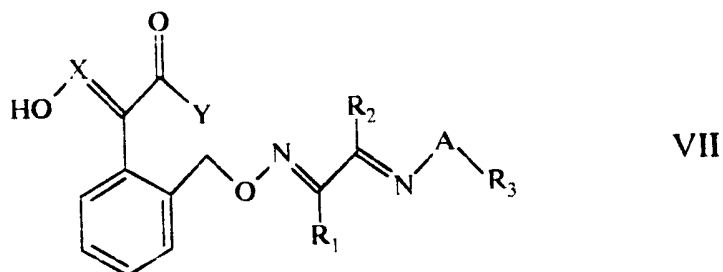
48. Метод съгласно претенция 47, характеризиращ се с това, че микроорганизмите са гъби.

49. Метод съгласно всяка една от претенции 43-46, характеризиращ се с това, че паразитите са насекоми или Asarina.

50. Метод съгласно всяка една от претенции 43-46, характеризиращ се с това, че се обработват семена.

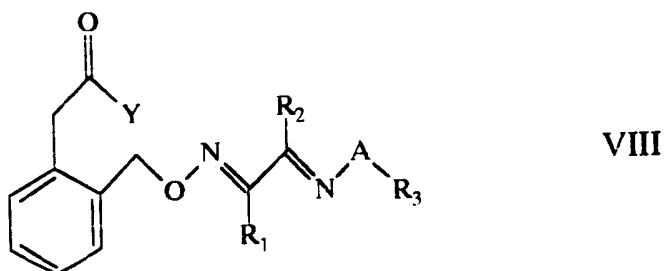
51. Семена, които се обработват съгласно претенция 50.

52. Съединение съгласно формула VII



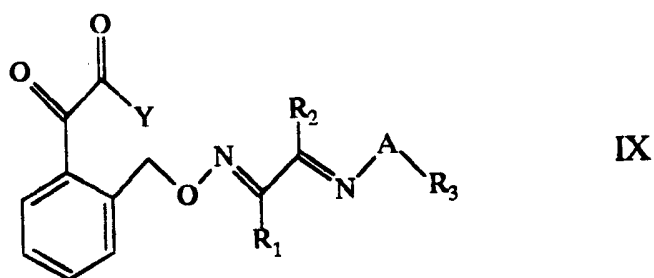
В която A, X, Y и R₁-R₃ са съгласно дефиницията за формула I в претенция 1.

53. Съединение съгласно формула VIII



В която A, Y и R₁-R₃ са съгласно дефиницията за формула I в претенция 1.

54. Съединение съгласно формула IX



в която A, Y и R₁-R₃ са съгласно дефиницията за формула I в претенция 1.

55. Съединения съгласно формули II.1 и II.2

