



(51)4 с 07 D 207/08, 231/14, 233/66,
249/10

ГОСУДАРСТВЕННЫЙ КОМИТЕТ
ПО ИЗОБРЕТЕНИЯМ И ОТКРЫТИЯМ
ПРИ ГНТ СССР

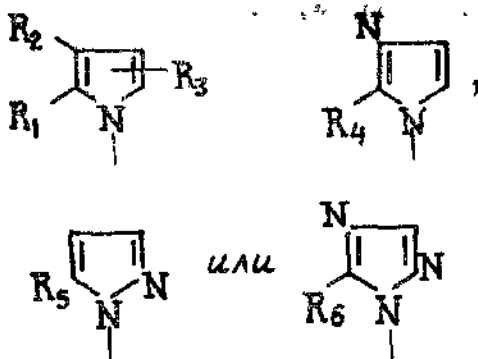
ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

К ПАТЕНТУ

- (21) 4027762/23-04
(22) 17.06.86
(31) 8515385; 8609453
(32) 18.06.85; 17.04.86
(33) GB
(46) 23.05.89, Бюл. № 19
(71) Империял Кемикал Индастриз ЛПС (GB)
(72) Пол де Фрейн, Брайен Кеннет Снелл, Джон Мартин Клау, Кевин Бьютмент и Вивьен Маргарет Энтони (GB)
(53) 547.741.772.1.781.2.792.2.07 (088.8)
(56) Общая органическая химия. /Под ред. Р. Бартона, В. Д. Оллис. М.: Химия, 1982, т. 2, с. 318.

(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ МЕТИЛОВЫХ ЭФИРОВ 2-ГЕТАРИЛ-3-МЕТОКСИАКРИЛОВОЙ КИСЛОТЫ

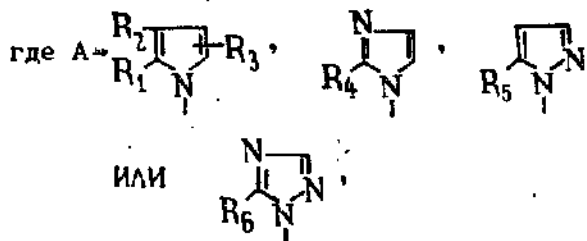
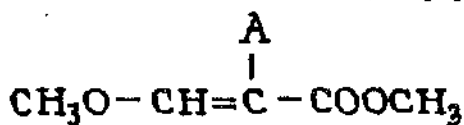
(57) Изобретение касается гетероциклических соединений, в частности получения метиловых эфиров 2-гетарил-3-метоксиакриловой кислоты формулы I $\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C}[\text{A}]-\text{C}[\text{C}]\text{OCH}_3$, где А - группа формулы



где $R_1 = \text{H}$, CN, фенилэтил, [E]-фенилэтилен, фенилтио, пиридилтио, формил,

C_{1-4} -алкилкарбонил [он может быть замещен Cl], C_{1-4} -алкоксикарбонил [он может быть замещен Cl], аллилоксикарбонил, фенилацетил, метоксикарбонилпропионил, этоксикарбонилпропионил, метоксалил, этоксалил, C_{1-4} -алкил- или диалкиламинокарбонил, фениламинокарбонил, бензоил [он может быть моно- или дизамещен F, Cl, C_{1-4} -алкилом, C_{1-2} -алкоксилем или карбоксилем], пиридилкарбонил [он может быть замещен Cl], тианзилкарбонил, фурилкарбонил, феноксикарбонил, феноксиметилкарбонил или бензилоксикарбонил; $R_2 = \text{H}$, фенилацетил или бензоил; $R_3 = \text{F}$, CH_3 , метоксикарбонил, один или два Cl; $R_4 = \text{C}_{1-4}$ -алкил, бензоил [он может быть моно- или дизамещен F, Cl, CH_3 или метоксилем] или тианзилкарбонил; $R_5 = [\text{E}]$ -фенилэтилен [он может быть замещен Cl]; $R_6 =$ фенил или [E]-фенилэтилен, которые обладают фунгицидным действием. Цель изобретения - создание новых активных соединений указанного класса. Синтез их ведут реакцией соединения формулы II $\text{HO}-\text{CH}=\text{C}[\text{A}]-\text{C}[\text{O}]-\text{OCH}_3$, где А - см. выше, или его соли щелочного металла с диметилсульфатом или метилгалогенидом в органическом инертном растворителе, причем при использовании соединения формулы II в свободном виде процесс ведут в присутствии основания. Новые соединения проявляют фунгицидную активность в отношении патогенных микроорганизмов, паразитирующих на пшенице, ячмене, яблоке, рисе, земляном орехе, винограде и томатах, а также некоторые из них активны в отношении грибов. 8 табл.

Изобретение относится к получению новых химических соединений, а именно метиловых эфиров 2-гетарил-3-метоксинакриловой кислоты общей формулы



- R_1 — водород, циано, фенилэтил, (Е)-фенилэтинил, фенилтио, пиридилтио, формил, C_1-C_4 -алкилкарбонил, незамещенный или замещенный хлором, C_1-C_4 -алкоксикарбонил, незамещенный или замещенный хлором, аллил- 25
локсикарбонил, фенилацетил, метоксикарбонилпропионил, этоксикарбонилацетил, фенилпропионил, метоксалил, этоксалил, C_1-C_4 -алкил- или диал- 30
киламинокарбонил, фениламинокарбонил, бензоил, незамещенный или моно- или дизамещенный фтором, хлором, C_1-C_4 -алкилом, C_1-C_2 -алкоксиллом или карбоксиллом, пиридилкарбонил, незамещенный или замещенный хлором, тиенилкарбонил, фурилкарбонил, феноксикарбонил, феноксиметилкарбонил или бензил- 40
илоксикарбонил;
- R_2 — водород, фенилацетил или бензоил;
- R_3 — водород, метил, метоксикарбонил, один или два хлора;
- R_4 — C_1-C_4 -алкил, бензоил, незамещенный или моно- или дизамещенный фтором, хлором, метилом или метоксилом, или тиенилкарбонил;
- R_5 — (Е)-фенилэтинил, незамещенный или замещенный хлором;
- R_6 — фенил или (Е)-фенилэтинил, который обладают фунгицидным действием.

Цель изобретения — разработка на основе известного метода способа получения новых соединений, обладающих фунгицидным действием.

Пример 1. Получение (Z)-метил-3-метокси-2[(Е)-стирилпиррол-1-ил]акрилат (соединение 1, табл. 1).

Гидрид натрия (2,4 г, 0,05 моль, 50% дисперсии в масле) промывают петролейным эфиром 40-60° и суспендируют в сухом тетрагидрофуране (ТГФ, 50 мл). По каплям на протяжении 1 ч при комнатной температуре добавляют пиррол-2-карбоксальдегид (4,75 г, 0,05 моль), в ТГФ (25 мл). Еще через 1,5 ч добавляют порциями хлористый бензилтрифенилфосфоний (19,5 г, 0,05 моль) (раствор становится красным, экзотермия) и перемешивают в течение 3 ч при 50°С. Смесь концентрируют при пониженном давлении, к остатку добавляют воду и осуществляется экстракция диэтиловым эфиром. После сушки сульфатом магния и упаривания получается вязкое красное масло. Очистка с помощью хроматографии на колонке с использованием силикагеля и смеси петролейный эфир 60-80°; диэтиловый эфир (1:1) в качестве элюента дает воскообразное твердое вещество (5,3 г). Данное вещество перекристаллизовывается из смеси петролейный эфир 60-80°; хлороформ, давая (Е)-2-стирилпиррол (1,5 г) в виде кристаллического твердого вещества, которое является нестабильным по отношению к свету.

Гидрид натрия (0,3 г, 0,0063 моль) промывают петролейным эфиром 60-80° и суспендируют в диметилформамиде (ДМФ, 25 мл). По каплям при комнатной температуре добавляют (Е)-2-стирилпиррол (1,0 г, 0,006 моль) в ДМФ (10 мл). После перемешивания в течение 1,5 ч по каплям добавляют метилбромацетат (0,56 мл, 0,006 моль) в ДМФ (5 мл). Через 16 ч смесь выливают в воду (200 мл) и экстрагируют эфиром (3×100 мл). Экстракты промывают соевым раствором, сушат и упаривают при пониженном давлении, давая коричневое масло. Очистка с помощью хроматографии на колонке с использованием силикагеля и смеси этилацетат:петролейный эфир 60-80° (1:1) в качестве элюента дает метил (2-стирилпиррол-1-ил/ацетат) (0,5 г, 30% выход) в виде темно-желтого аморфного твердого вещества.

Гидрид натрия (0,63 г, 0,013 моль) промывают бензином 60-80° и суспенди-

руют в ДМФ (30 мл) в атмосфере азота. К нему добавляют по каплям при комнатной температуре метил(2-стирилпиррол-1-ил)ацетат (1,6 г, 0,0066 моль) и метилформиат (8,2 мл, 0,13 моль) в ДМФ (10 мл). Через 4 ч смесь выливают в 200 мл насыщенного бикарбоната натрия, экстрагируют диэтиловым эфиром (2×100 мл), затем водный слой нейтрализуют концентрированной соляной кислотой и экстрагируют снова диэтиловым эфиром (2×100 мл). Данное вещество промывается соевым раствором, сушится и упаривается, давая метил 3-гидрокси-2-[(Е)-2-стирилпиррол-1-ил]акрилат (2,0 г) в виде оранжево-желтого масла. Данное вещество использовалось в следующей реакции без дополнительной очистки.

К перемешиваемой суспензии карбоната калия (1,8 г, 0,013 моль) в ДМФ (50 мл) добавляют по каплям метил 3-гидрокси-2-[(Е)-2-стирилпиррол-1-ил/акрилат] (2,0 г, 0,0074 моль) в ДМФ (20 мл). После перемешивания в течение 2 ч при комнатной температуре добавляется по каплям диметилсульфат (0,63 мл, 0,0067 моль) (слегка экзотермическая реакция). Смесь перемешивают в течение 16 ч, затем выливают в насыщенный раствор бикарбоната натрия (200 мл) и экстрагируют диэтиловым эфиром (2×100 мл). Экстракты промывают соевым раствором, сушат и упаривают при пониженном давлении, давая вязкое оранжевое масло. Очистка с помощью хроматографии на колонке с использованием силикагеля со смесью диэтилового эфира и бензина 60-80° (1:1) в качестве элюента дает целевое соединение (700 мг, 37% выход) в виде бледно-желтого твердого вещества, плавящегося при 126-128°C.

Пример 2. (Z)-Метил-3-метокси-2-(2-бензоилпиррол-1-ил)акрилата (соединение 2, табл. 1).

Трет-бутилат калия (7,22 г, 0,064 моль) растворяется в ДМФ (40 мл) и по каплям при перемешивании при комнатной температуре добавляют 2-бензоилпиррол (10 г, 0,058 моль) в ДМФ (10 мл). Смесь оставляют на 16 ч, затем охлаждают до 0°C, при этом добавляют по каплям метилбромацетат (5,4 мл, 0,058 моль) в ДМФ (5 мл). Реакционную смесь перемешивают в течение 16 ч, затем выливают в воду

(150 мл) и экстрагируют диэтиловым эфиром (2×100 мл). Экстракты промывают соевым раствором (2×75 мл); сушат и упаривают, давая метил(2-бензоилпиррол-1-ил)ацетат (12,6 г, 89%) в виде коричневого масла, которое кристаллизуется при стоянии.

Гидрид натрия (1,44 г, 55% в масле, 0,033 моль) промывают бензином 60-80° и суспендируют в ДМФ (15 мл). К смеси по каплям при комнатной температуре добавляют метил(2-бензоилпиррол-1-ил)ацетат (4,0 г, 0,0165 моль) в ДМФ (15 мл) и метилформиат (20,3 мл, 0,33 моль). Через 4 ч смесь выливают в 200 мл 10% карбоната калия, промывают диэтиловым эфиром (2×100 мл), затем водная фаза нейтрализуется концентрированной соляной кислотой и экстрагируется диэтиловым эфиром (2×100 мл). Эти экстракты промывают соевым раствором, сушат и упаривают, давая метил-3-гидрокси-2-(2-бензоилпиррол-1-ил)акрилат (3,86 г, 86%) в виде белого кристаллического твердого вещества, плавящегося при 112-113°C.

К перемешиваемой суспензии карбоната калия (5,0 г, 0,037 моль) в ДМФ (50 мл) добавляют по каплям метил 3-гидрокси-2-(2-бензоилпиррол-1-ил)акрилат (5,0 г, 0,0185 моль) в ДМФ (10 мл). После перемешивания в течение 2 ч при комнатной температуре по каплям добавляют диметилсульфат (1,75 мл, 0,0185 моль) (слегка экзотермическая реакция). Данную смесь перемешивают в течение 3 ч, затем выливают в насыщенный раствор бикарбоната натрия (200 мл), экстрагируют диэтиловым эфиром (2×100 мл). Экстракты промывают соевым раствором, сушат и упаривают при пониженном давлении, давая вязкое оранжевое масло. Очистка с помощью хроматографии на колонке из силикагеля с использованием в качестве элюента этилацетата дает целевое соединение (3,7 г, 70%) в виде белого кристаллического твердого вещества, плавящегося при 78-79°C.

Пример 3. (Z)-Метил-3-метокси-2-(5-фенил-1,2,4-триазол-1-ил)акрилата (соединение 1, табл. 5).

п-[(Диметиламино)метил]бензамид (2,0 г, 0,011 моль) и гидрохлоридная соль ацетата метилгидразина (1,9 г, 0,011 моль) подогревают в уксусной

кислоте при 90°C в течение 1,5 ч. Уксусная кислота упаривается при пониженном давлении, и остаток нейтрализуется насыщенным водным раствором бикарбоната натрия, затем экстрагируют в хлороформ (2×100 мл), промывают водой, сушат и упаривают при пониженном давлении, давая метил (5-фенил-1,2,4-триазол-1-ил) ацетат в виде светлого масла (2,3 г, 96%).

Гидрид натрия (0,88 г, 0,018 моль, 50% дисперсия в масле) промывают сухим бензином 40–60° и суспендируют в ДМФ (15 мл). При комнатной температуре, при перемешивании на протяжении 10 мин добавляют смесь метил (5-фенил-1,2,4-триазол-1-ил)ацетата (2,0 г, 0,009 моль) и метилформната (11,4 мл, 0,18 моль) в ДМФ (15 мл). Через 2 ч добавляют водный карбонат калия (200 мл, 10%) и водный слой экстрагируют диэтиловым эфиром (2×100 мл), затем водный слой нейтрализуют концентрированной соляной кислотой, а затем экстрагируют этилацетатом (3×150 мл). Этилацетатный экстракт промывают солевым раствором и сушат, затем упаривают при пониженном давлении, давая метил 3-гидрокси-2-(5-фенил-1,2,4-триазол-1-ил)акрилат (2,2 г) в виде желтого масла.

К перемешиваемой суспензии карбоната калия (2,6 г, 0,018 моль) в ДМФ (25 мл) добавляют по каплям метил 3-гидрокси-2-(5-фенил-1,2,4-триазол-1-ил)акрилат (2,2 г, 0,009 моль) в ДМФ (10 мл). После перемешивания в течение 1,5 ч при комнатной температуре добавляют диметилсульфат (0,87 мл, 0,009 моль) (легкая экзотермия). Данную смесь перемешивают в течение 3 ч, затем выливают в воду (150 мл) и экстрагируют этилацетатом (3×75 мл). Экстракты промывают солевым раствором, сушат и упаривают при пониженном давлении, давая чистое масло. Очистка с помощью хроматографии на колонке из силикагеля с использованием в качестве элюента этилацетата дает целевое соединение (1,5 г, 64%) в виде чистого масла.

Пример 4. (Z)-Метил-3-метокси-2-(пиррол-1-ил)акрилата (соединение 55, табл. 1).

Раствор хлористоводородной соли сложного метилового эфира глицина (6,30 г) и ацетата калия (8,00 г) в воде (10 мл) добавляют к ледяной ук-

сусной кислоте (50 мл). Полученную в результате смесь нагревают до кипения с обратным холодильником, в виде одной порции добавляют 2,5-диметокситетрагидрофуран (6,60 г) и нагревание при кипячении с обратным холодильником продолжают в течение 4 ч. После охлаждения реакционную смесь нейтрализуют бикарбонатом натрия и экстрагируют этилацетатом. Экстракты промывают водой, сушат, концентрируют при пониженном давлении и перегоняют при 125°C и давлении приблизительно 15 торр с использованием аппарата для молекулярной перегонки, давая метил пиррол-1-ил-ацетат (2,62 г, 38% выход) в виде бесцветной жидкости, ИК спектр (пленка) 1750 см⁻¹.

Раствор метил пиррол-1-ил-ацетата (2,00 г) в метилформнате (4,4 мл) добавляют по каплям к перемешиваемой суспензии гидрида натрия (0,38 г) в сухом толуоле (10 мл), охлажденной на ледяной бане. Смесь подогревают до комнатной температуры, добавляют 2 капли сухого метанола (бурное выделение газа) и смесь медленно нагревают до 50°C, после чего смесь становится сначала светлой, затем отлагается густое не совсем белое твердое вещество. Смесь нагревают при 50°C в течение 30 мин, охлаждают и разбавляют эфиром. Твердое вещество отфильтровывают, промывают эфиром и частично сушат, давая белое твердое вещество (3,12 г), ИК спектр (пленка) 1665, 1640 см⁻¹. Метилиодид (0,93 мл) в виде одной порции добавляют к перемешиваемой суспензии данного твердого вещества в ДМФ (20 мл). После перемешивания при комнатной температуре в течение 2 ч смесь выливают в воду и экстрагируют эфиром. Экстракты промывают водой, сушат и концентрируют, давая белое твердое вещество (2,35 г), которое растирают с бензином и сушат, давая целевое соединение (1,73 г, 66% выход) в виде белого твердого вещества, точка плавления 88–89°C, ИК спектр (нуйол) 1700, 1635 см⁻¹, спектр ПМР (CDCl₃): 3,77 (3H, синглет), 3,91 (3H, синглет), 6,26 (2H, триплет, J 5 Гц), 6,69 (2H, триплет, J 5 Гц), 7,51 (1H, синглет).

В табл. 1 представлены производные пиррола, в табл. 2 – производные имидазола, в табл. 3 – производные

пиразола, в табл. 4 - производные 1,2,4-триазола, полученные по предлагаемому способу.

Соединения 1 испытывались против множества грибковых заболеваний листьев растений.

Применяемая технология следующая.

Растения выращивают в компосте для горшков в минигоршках диаметром 4 см. Испытываемые соединения преобразовывают в препаративные формы или с помощью измельчения бусинками с водным дисперзолом Т или в виде раствора в ацетоне или смеси ацетон/этанол, который разбавляют до требуемой концентрации непосредственно перед использованием. От заболеваний листья препаративные формы (100 част./мин активного ингредиента) распыляют на листву и применяют к корням растений в почве. Опрыскивающие препараты (спреи) применяют для максимального удерживания и корни дренируют до конечной концентрации эквивалентной приблизительно 40 млн. дол. активн. ингр./сухую почву. Когда опрыскивающие препараты применяют по отношению к хлебным злакам, добавляют Тлин 20 для достижения окончательной концентрации 0,05%.

В случае большинства испытаний соединения применялось по отношению к почве (корням) и к листве (при опрыскивании) за один или два дня до заражения растения болезнью. Исключение составляет испытание с ячменем, при котором растения инокулировались болезнетворными организмами за 24 ч до обработки. Патогенные организмы, паразитирующие на листве, применяют путем опрыскивания в виде суспензии спор листьев испытываемых растений. После инокулирования растения помещают в соответствующие условия окружающей среды для обеспечения возможности проникновения инфекции, а затем инкубируют до тех пор, пока заболевание не готово для оценки. Период между инокуляцией и оценкой варьируется от 4 до 14 дн. в зависимости от заболеваний и окружающей среды.

Борьбу с заболеванием регистрируют по следующей шкале: 4 = отсутствие заболевания; 3 = следы - 5% заболевания от необработанных растений; 2 = 6-25% заболевания от необработанных растений; 1 = 26-59% заболевания

от необработанных растений; 0 = 60-100% заболевания от необработанных растений; - = испытаний не проводились. Результаты испытаний представлены в табл. 5 - 7.

Проведены также следующие испытания.

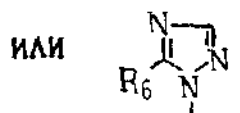
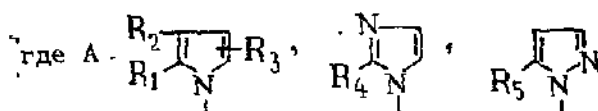
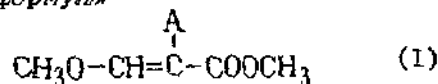
Испытуемые соединения готовили в шаровой мельнице с водным дисперзолом Т или в виде растворов в ацетоне или ацетон-этаноле. Их разбавляли до 100 млн долей водой и аликвоты по 2,5 мл вносили в чашки Петри. Аликвоты дополнительно разбавляли до 25 млн долей (активного компонента) картофельным агаром с декстрозой.

Чашки засеивали патогенными грибами, используя либо суспензию спор или мицелиальную массу, и затем выдерживают при соответствующих температурах (19-25°C). Контроль роста проводили через два дня, используя индексы 0, 2 или 4. Результаты испытаний приведены в табл. 8. (Cs - *Cladosporium Sphaerospermum*, Pp - *Pullularia Pullulans*, At - *Alternaria Tenuis*, An - *Aspergillus Niger*, Tv - *Trichoderma Viride*, Pd - *Penicillium Digitatum*, Cm - *Colletotrichum Musae*, Bc - *Botrytis Cinerea*, Fc - *Fusarium Culmorum*, Gc - *Geotrichum Candidum*, Va - *Verticillium Albo-Atrum*, Pc - *Phytophthora Cinnamomi*, Cc - *Colletotrichum Coffeanum*, Ch - *Pseudocercospora Herpotrichoides*, Cb - *Cercospora Beticola*, Sn - *Septoria Nodorum*).

Таким образом, данный способ позволяет получать новые метиловые эфиры 2-гетарил-3-метоксинакриловой кислоты, обладающие фунгицидной активностью.

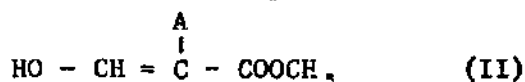
Ф о р м у л а и з о б р е т е н и я

Способ получения метиловых эфиров 2-гетарил-3-метоксинакриловой кислоты общей формулы



- R_1 - водород, циано, фенилэтил, (E)-фенилэтенيل, фенилтио, пиридилтио, формил, C_1-C_4 -алкилкарбонил, незамещенный или замещенный хлором, C_1-C_4 -алкоксикарбонил, незамещенный или замещенный хлором, аллил-оксикарбонил, фенилацетил, метоксикарбонилпропионил, этоксикарбонилпропионил, фенилпропионил, метоксалил, этоксалил, C_1-C_4 -алкил- или диалкиламинокарбонил, фениламинокарбонил, бензоил, незамещенный или моно- или дизамещенный фтором, хлором, C_1-C_4 -алкилом, C_1-C_2 -алкоксиллом или карбоксиллом, пиридилкарбонил, незамещенный или замещенный хлором, тиенилкарбонил, фурилкарбонил, феноксикарбонил, феноксиметилкарбонил или бензилоксикарбонил;
- R_2 - водород, фенилацетил или бензоил;
- R_3 - водород, метил, метоксикарбонил, один или два хлора;
- R_4 - C_1-C_4 -алкил, бензоил, незамещенный или моно-, или дизамещенный фтором, хлором, метилом или метоксиллом, или тиенилкарбонил;
- R_5 - (E)-фенилэтенил, незамещенный или замещенный хлором;

R_5 - фенил или (E)-фенилэтенил, отличающийся тем, что соединение общей формулы



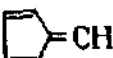
где А имеет указанные значения, или его соль щелочного металла подвергают взаимодействию с диметилсульфатом или метилгалогенидом в органическом инертном растворителе, причем при использовании соединения общей формулы II в свободном виде процесс ведут в присутствии основания.

Приоритет по признакам:

18.06.85 при R_1 - циано, фенилэтил, (E)-фенилэтенил, или фениламинокарбонил, R_5 - (E)-фенилэтенил, незамещенный или замещенный хлором.

17.04.86 при R_1 - C_1-C_4 -алкилкарбонил, незамещенный или замещенный хлором, бензоил, незамещенный или моно-, или дизамещенный фтором, хлором, C_1-C_4 -алкил, C_1-C_2 -алкоксиллом или карбоксиллом, пиридинкарбонил, тиенилкарбонил, фурилкарбонил, феноксикарбонил, феноксиметилкарбонил или бензилоксикарбонил, R_2 - метил или метоксикарбонил, R_4 - C_1-C_4 -алкил, бензоил, незамещенный или моно- или дизамещенный фтором, хлором, метилом или метоксиллом или тиенилокарбонил, R_5 - фенил или (E)-фенилэтенил.

Таблица 1

Соединение	$\begin{array}{c} R_2 \\ \\ R_1 - \text{C} - R_3 \\ \\ \text{N} \\ \\ \text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C}-\text{COOCH}_3 \end{array}$				
	R_1	R_2	R_3	Температура плавления, °C	Изомер
1	2	3	4	5	6
1	E- $C_6H_5CH=CH$	H	H	126-128	Z
2	C_6H_5CO	H	H	78-79	Z
3	CN	H	H	97	Z
4	C_6H_5CH	H	H		Z
5	C_5H_{11}	H	H		Z
6	$C_6H_5CH_2CF_2$	H	H	70-71	Z
7	$C_6H_5N(Me)CO$	H	H		Z
8	 -CH	H	H		Z

- Продолжение табл. 1

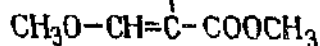
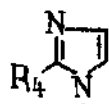
1	2	3	4	5	6
9	H	C ₆ H ₅ CO	H	Масло	Z
28	3-ClC ₆ H ₄ CO	H	H	108	Z
29	C ₃ H ₇ OCO	H	H	Масло	Z
30	трет-C ₄ H ₉ OCO	H	H	Масло	Z
31	C ₆ H ₅ CH ₂ OCO	H	H	114-5	Z
32	C ₆ H ₅ OCO	H	H	119-120	Z
33	C ₆ H ₅ COCO	H	H		Z
34	2-C ₄ H ₉ O-CO	H	H	85-6	Z
35	2-C ₅ H ₁₁ N-CO	H	H	106-8	Z
36	2-C ₆ H ₅ S	H	H	Масло	Z
37	C ₆ H ₅ CO	H	5-CN		Z
38	C ₆ H ₅ CO	H	5-CO ₂ CH ₃	Масло	Z
39	C ₅ H ₁₁ N-CH ₂	H	H		Z
40	3-CH ₃ C ₆ H ₄ CO	H	H	110-1	Z
41	4-FC ₆ H ₄ CH ₂	H	H		Z
42	4-FC ₆ H ₄ CH ₂ CH ₂	H	H		Z
43	3-C ₄ H ₉ S-CO	H	H	130-1	Z
44	3-C ₄ H ₉ O-CO	H	H		Z
45	3-C ₅ H ₁₁ N-CO	H	H	Масло	Z
46	2-(5-Cl-C ₅ H ₉) CO	H	H		Z
47	H	H			Z
48	C ₆ H ₅ OCH ₂	H	H		Z
49	C ₆ H ₅ CHCH ₃	H	H		Z
50	C ₃ H ₇ CHCH ₃	H	H		Z
51	-(CF ₃) ₂ CHOCO	H	H		Z
52	-C ₆ H ₅ CO	CH ₃	H		Z
53	C ₆ H ₅ CO	H	4CF ₃		Z
54	3-CH ₃ OC ₆ H ₄ CO	H	H	92-3	Z
55	H	H	H	88-9	Z
56	3-(6-Cl-C ₅ H ₉) CO	H	H	Масло	Z
57	2-(5-Br-C ₅ H ₉) CO	H	H		Z
58	3-CN C ₆ H ₄ CO	H	H	110 (раз- лож.)	Z
59	3,5-F ₂ C ₆ H ₃ CO	H	H	99	Z
60	C ₆ H ₅ OCH ₂ CO	H	H	Масло	Z
61	4-FC ₆ H ₄ OCH ₂ CO	H	H		Z
62	3,5-di-CH ₃ OC ₆ H ₃ CO	H	H	91	Z
63	3-NO ₂ C ₆ H ₄ CO	H	H		Z
64	3-BrC ₆ H ₄ CO	H	H		Z
65	3-C ₂ H ₅ C ₆ H ₄ CO	H	H		Z
66	3,5-di-CH ₃ C ₆ H ₃ CO	H	H	82-3	Z
67	3-C ₂ H ₅ OC ₆ H ₄ CO	H	H	Масло	Z
68	3-FC ₆ H ₄ OCH ₂	H	H		Z
69	2,3-Cl ₂ C ₆ H ₃ CO	H	H	118	Z
70	2,3-F ₂ C ₆ H ₃ CO	H	H		Z
71	2-Пиримидил-CO	H	H		Z
72	4-Пиримидил-CO	H	H		Z
73	ди-CH ₃ NSO	H	H		Z
74	C ₆ H ₅ CO	H	4,5-диCl	123-5	Z

- Продолжение табл. 1

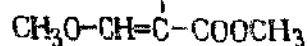
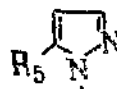
1	2	3	4	5	6
75	C_6H_5CO	H	5-Cl	103-4	Z
76	CHO	H	H	58-9	Z
77	CH_3CO	H	H	101-3	Z
78	H	CH_3CO	H	Масло	Z
79	$C_2H_5OCOCH_2CO$	H	H	Масло	Z
80	$ClCH_2CH_2CH_2CO$	H	H	Масло	Z
81	$2-POOCC_6H_4CO$	H	H	150	Z
82	$-CH_3OCOCO$	H	H	118	Z
83	$ClCH_2CO$	H	H	104	Z
84	C_3H_7CO	H	H	Масло	Z
85	C_2H_5OCOCO	H	H	Масло	Z
86	C_2H_5OCOCO	H	H	87	Z
87	H	$(CH_3)_2CHCH_2CO$	H	Масло	Z
88	$CH_3C_2H_5CHCO$	H	H	Масло	Z
89	$(CH_3)_2CHCH_2CO$	H	H	Масло	Z
90	$CH_3OCOCH_2CH_2CO$	H	H	127	Z
91	H	$CH_3OCOCH_2CH_2COH$	H	Масло	Z
92	$C_6H_5CH_2CH_2CO$	H	H	98	Z
93	$3-FC_6H_4CO$	H	5- CH_3	Масло	Z
94	$3-CH_3C_6H_4CO$	H	5- CH_3	Масло	Z
95	$(CH_3)_2CHCH_2OCO$	H	H	Масло	Z
96	$C_6H_5CH_2CO$	H	H	68-9	Z
97	H	H	H	118-9	Z
98	C_4H_9CO	H	H	49-50	Z
99	C_3H_7NHCO	H	H	100-1	Z
100	C_2H_5OCO	H	H	Масло	Z
101	C_6H_5NHCO	H	H	199	Z
102	$(C_2H_5)_2CO$	H	H	Масло	Z
103	$CH_3C_2H_5CHOCO$	H	H	Масло	Z
104	C_4H_9OCO	H	H	Масло	Z
105	$-CH_2=CHCH_2OCO$	H	H	Масло	Z
106	CCl_3CH_2OCO	H	H	Масло	Z
107	$4-C_6H_4N-CO$	H	H	114-50	Z
108	C_3H_7OCO	H	H	70-1	Z

Т а б л и ц а 2

Т а б л и ц а 3

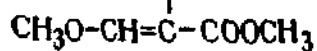
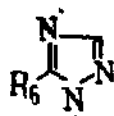


Соединение	R_4	Т. пл., °C	Изомер
1	C_6H_5CO	Масло	Z
2	$2-ClC_6H_4CO$	159	Z
3	HC_4H_9	Масло	Z
4	$4-ClC_6H_4CO$	108-9	Z
5	$4-FC_6H_4CO$	115-117	Z
6	$4-CH_3C_6H_4CO$	103-4	Z
7	$3,5-Cl_2C_6H_3CO$	130-1	Z
8	$2-C_4H_9S-CO$	116-118	Z
9	CH_3	81-2	Z
10	$4-CH_3OC_6H_4CO$	104-5	Z
11	$3-FC_6H_4CO$	76-7	Z



Соединение	R_5	Т. пл., °C	Изомер
1	$E-4-ClC_6H_4CH=CH$	138-9	Z
2	$E-2,6-ди-ClC_6H_3CH=CH$	119-121	Z
3	$E-C_6H_5CH=CH$	138	Z

Т а б л и ц а 4



Соединение	R ₆	Т.пл., °C	Изомер
1	C ₆ H ₅	Масло	Z
2	E-C ₆ H ₅ CH=CH	116-7	Z

Т а б л и ц а 5

Соединение	Функциционная активность						
	Пшеница	Ячмень	Яблоня	Рис	Земляной орех	Виноград	Томаты
1	4	0	4	4	4	4	-
2	4	4	4	4	2	4	-
3	0	4	4	3	4	4	-
9	0	0	2	0	0	2	-
10	3	4	3	3	4	4	-
11	4	4	-	4	4	4	-
12	2	0	1	0	0	4	-
13	3	3	4	4	4	4	-
14	4	4	4	4	4	4	-
15	4	4	-	4	3	4	-
16	0	0	1	0	0	0	-
18	0	1	1	0	0	0	-
20	4	4	4	4	4	4	-
21	2	4	4	0	4	0	-
22	3	4	4	3	0	4	-
23	3	4	4	4	4	4	-
24	4	4	4	4	4	4	-
25	2	4	2	3	4	4	-
26	0	1	2	0	4	0	-
27	4	4	4	4	4	4	-
28	4	4	4	4	4	4	3
29	4	4	4	4	4	4	-
30	4	4	4	3	4	4	2
6	3	0	4	4	0	4	4
29	4	4	4	4	-	4	3
31	0	4	0	0	0	0	0
32	4	4	3	4	4	4	0
34	4	4	4	2	3	0	-
35	4	4	4	0	3	4	0
36	0	0	4	0	1	0	0
38	0	0	0	0	3	0	0
40	4	4	4	4	4	0	-
43	4	4	4	4	4	4	1
45	0	0	0	0	4	0	0
54	3	4	4	4	4	4	2
55	0	0	0	3	0	0	0
56	2	4	4	0	4	3	0

Соединение	Фунгицидная активность						
	Пшеница	Ячмень	Яблоня	Рис	Земляной орех	Виноград	Томаты
59	4	4	4	4	4	4	3
60	0	4	4	3	4	4	0
62	4	3	4	3	4	4	2
66	4	4	4	4	4	4	3
67	3	4	4	4	4	4	0
69	0	0	4	4	4	4	0
74	3	3	0	1	0	2	0
75	3	4	2	3	3	-	0
76	0	1	0	0	3	0	0
77	3	4	4	0	1	0	0
80	0	4	3	0	2	0	0
81	0	0	4	0	0	0	0
83	0	0	0	0	2	0	0
84	3	0	4	4	3	4	0
86	0	0	0	3	0	0	0
88	3	4	4	3	3	0	0
89	3	4	4	3	3	0	0
90	3	0	0	0	2	0	0
92	2	4	4	1	4	4	0
93	4	4	4	4	2	4	0
94	0	4	4	2	0	2	3
95	4	4	4	4	4	-	2
96	4	4	4	3	4	-	0
97	0	0	0	0	4	-	0
98	4	4	4	4	4	4	3
99	0	0	0	0	3	0	0
100	4	4	4	4	4	4	4
101	0	0	0	0	3	0	0
102	0	0	3	0	3	0	0
103	3	4	4	3	0	4	0
104	4	4	0	4	0	3	3
105	4	4	4	4	4	4	4
106	4	4	4	3	2	4	0
107	4	3	3	0	4	0	0
108	4	4	4	4	-	4	4

Т а б л и ц а 6

Соединение	Патогенный организм (сельскохозяйственная культура)						
	Пшеница	Ячмень	Яблоня	Рис	Земляной орех	Виноград	Помидоры
1	4	3	4	4	4	4	-
2	0	0	4	0	4	0	-
3	0	3	1	0	0	0	-
5	4	4	4	4	4	3	3
6	0	0	4	0	0	3	-
7	1	0	4	3	4	3	2
8	2	0	4	4	4	3	0

Продолжение табл.6

Соедине- ние	Патогенный организм (сельскохозяйственная культура)						
	Пшеница	Ячмень	Яблоня	Рис	Земляной орех	Виноград	Поми- доры
9	0	0	0	0	0	3	0
10	1	0	0	0	4	2	0
4	3	0	0	2	4	4	0
11	4	4	4	4	3	4	-

Т а б л и ц а 7

Соедине- ние табл. 3	Патогенный организм (сельскохозяйственная культура)						
	Пшеница	Ячмень	Яблоня	Рис	Арахис	Виноград	Томаты
1	1	0	0	0	-	0	-
3	2	4	4	1	3	0	-

Т а б л и ц а 8

Соеди- нение	Номер табли- цы	С	Рр	А	А	Т	Ро	С	Вс	Гс	Сс	а	Рс	Сс	С	Со
55	1	0	4	4	0	0	4	0	0	0	0	2	0	2	2	0
79	1	2	4	4	2	2	2	2	2	2	2	4	2	2	4	2
82	1	2											2	4	4	2
85	1	2	2	4	2		2	2	2	2	2	2				
1	4	0	2	2	2	2	2	2	2	0	2	2	0	0		0
2	4	2	2		2	2	2	2	2	2	2	2	2	2		2

П р и м е ч а н и е. 0 - влияние на рост отсутствует.
2 - частичное подавление роста грибов.
4 - полное подавление роста грибов.

Составитель И.Бочарова

Редактор Л.Зайцева

Техред Л.Сердюкова

Корректор С.Шекмар

Заказ 2703/58

Тираж 352

Подписное

ВНИИПИ Государственного комитета по изобретениям и открытиям при ГКНТ СССР
113035, Москва, Ж-35, Раушская наб., д. 4/5

Производственно-издательский комбинат "Патент", г.Ужгород, ул. Гагарина, 101

