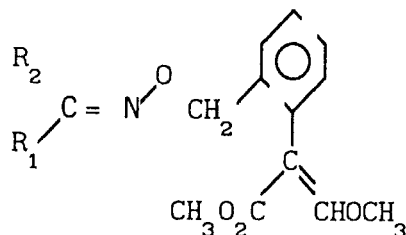
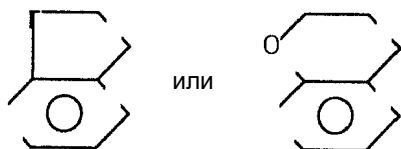


Изобретение относится к производным пропе-новой кислоты, общей формулы I:



и его стереоизомерам, где R_1 - C_1 - C_4 - алкил, C_1 - C_4 -алкокси, $COOR_3$, где R_3 - C_1 - C_4 -алкил, $PO(OR_3)_2$, COR_4 , где R_4 - C_1 - C_4 -алкил или фенил или R_1 является бензилом, фенилом или пириди-лом или его N-оксидом, пиримидинилом, пиррази-нилом, пиридазинилом, хинолилом, пирролилом, тиазолилом, фуранилом, триазилином, бензита-золилом, бензоксазолилом, изоксазолилом, тие-нилом, хиноксоминилом, фенилэтенилом, оксазо-лилом, C_1 - C_4 -алкилтио, причем фенил и каждый из гетероциклических остатков могут быть замещены одним или двумя заместителями из числа: гало-ген, C_1 - C_4 -алкилтио, C_1 - C_4 -алкил, гало-(C_1 - C_4)-алкил, C_1 - C_4 -алкокси, гало (C_1 - C_4)-алкокси, C_2 - C_4 -алкенилокси, C_2 - C_4 -алкинилокси, amino, нитро, циано, SO_2R_3 , фенил, замещенный циано, фенок-си, пиримидинилокси, бензилокси, CO_2R_3 , $CONH_2$, SR_3 ; R_2 - водород, галоген, C_1 - C_4 -алкил, CF_3 , C_3 - C_6 -циклоалкил, пиримидинил, amino, ди-(C_1 - C_4)-алкиламино, имидазолил, пирролил, пиридил, C_1 - C_4 -алкокси, $S(O)_nR_3$, $n=0, 1, 2$; CO_2R_3 циано, где R_3 - C_1 - C_4 -алкил или R_1 и R_2 вместе друг с другом об-разуют циклические системы:



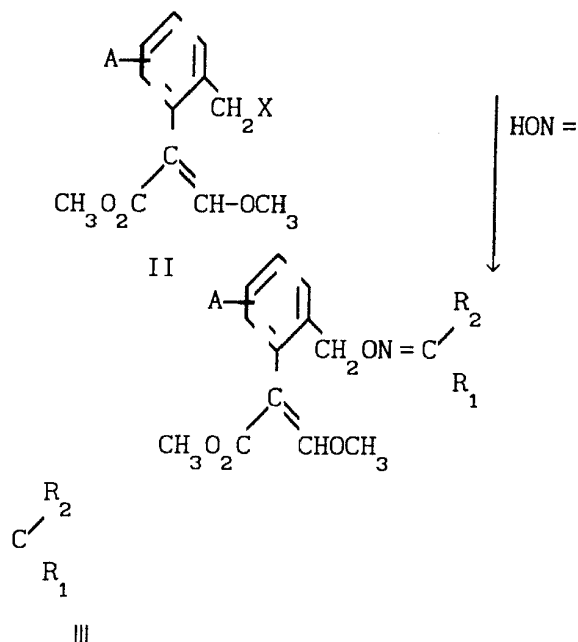
при условии, что когда R_1 - пиримидинил, R_2 не может быть SC_2H_5 или OC_6H_5 , обладающие фун-гицидной активностью.

Цель изобретения - разработка новых соеди-нений, обладающих высокой фунгицидной актив-ностью.

Изобретение иллюстрируется соединениями, перечисленными в табл. 1-4. В табл. 1-4 метил-3-метоксипропеноатная группа имеет (E)-конфигу-рацию.

Соединения формулы I могут быть получены с помощью процесса, показанного на Схеме 1, где A, R_1 и R_2 имеют значения, определенные выше и X представляет собой удаляемую группу, такую, как галоен (хлор, бром или иод).

Схема 1



Соединения формулы I могут быть получены с помощью обработки оксимов общей формулы III подходящим основанием, таким как гидрид натрия или метилат натрия в подходящем растворителе таком, как N,N-диметилформамид или тетрагидро-фуран, с образованием аниона, а затем добавле-ния соединения формулы II.

Оксимы общей формулы III хорошо известны в химической литературе. Соединение общей фо-рмулы II, в которой X представляет собой бром, и пропеноатная группа имеет (E)-конфигурацию.

Альтернативно соединения изобретения формулы 3(1) могут быть получены с помощью процесса, показанного на Схеме 2, где A, R₁, R₂ и X имеют значения, определенные выше; R₅ представляет собой водород или металл (такой как натрий или калий), 1 представляет собой удаляемую группу, такую как галогенидную (хлорид, бромид или иодид), CH₃SO₄ анион или сульфонильный анион. Каждый процесс преобразования (трансформации), осуществляется при подходящей температуре и обычно, хотя и не всегда, в подходящем растворителе.

Соединения изобретения формулы I могут быть получены из фенилацетатов формулы VI или сложных кетофиров формулы X с помощью процесса, показанного на Схеме 2.

Так, соединения формулы I могут получаться с помощью обработки фенилацетатов формулы VI основанием (таким, как гидрид натрия или метилат натрия) и метилформатом. Если к реакционной смеси затем добавляется соединение формулы CH₃L, где L имеет значения, определенные выше, могут быть получены соединения формулы I. Если к реакционной смеси добавляется протонная кислота, получают соединения формулы IX, где R₅ представляет водород. Альтернативно, соединения формулы IX, где R₅ представляет металл X, такой как натрий, могут сами по себе выделяться из реакционной смеси.

Соединения формулы IX могут превращаться в соединения формулы I с помощью обработки соединением CH₃L, где L имеет значения, определенные выше. Соединения формулы IX, где R₅ - водород, могут превращаться в соединения формулы I с помощью последовательной обработки основанием, таким, как карбонат калия, и соединением общей формулы CH₃L.

Альтернативно, соединения формулы I могут получаться из ацетатной формулы IV с помощью удаления метанола или в кислых или в основных условиях. Примерами реагентов или смесей реагентов, которые могут использоваться для данной трансформации, являются литий-диизопропил-амид, кислый сульфат калия и триэтиламин часто в присутствии кислоты Льюиса, такой как четыреххлористый титан.

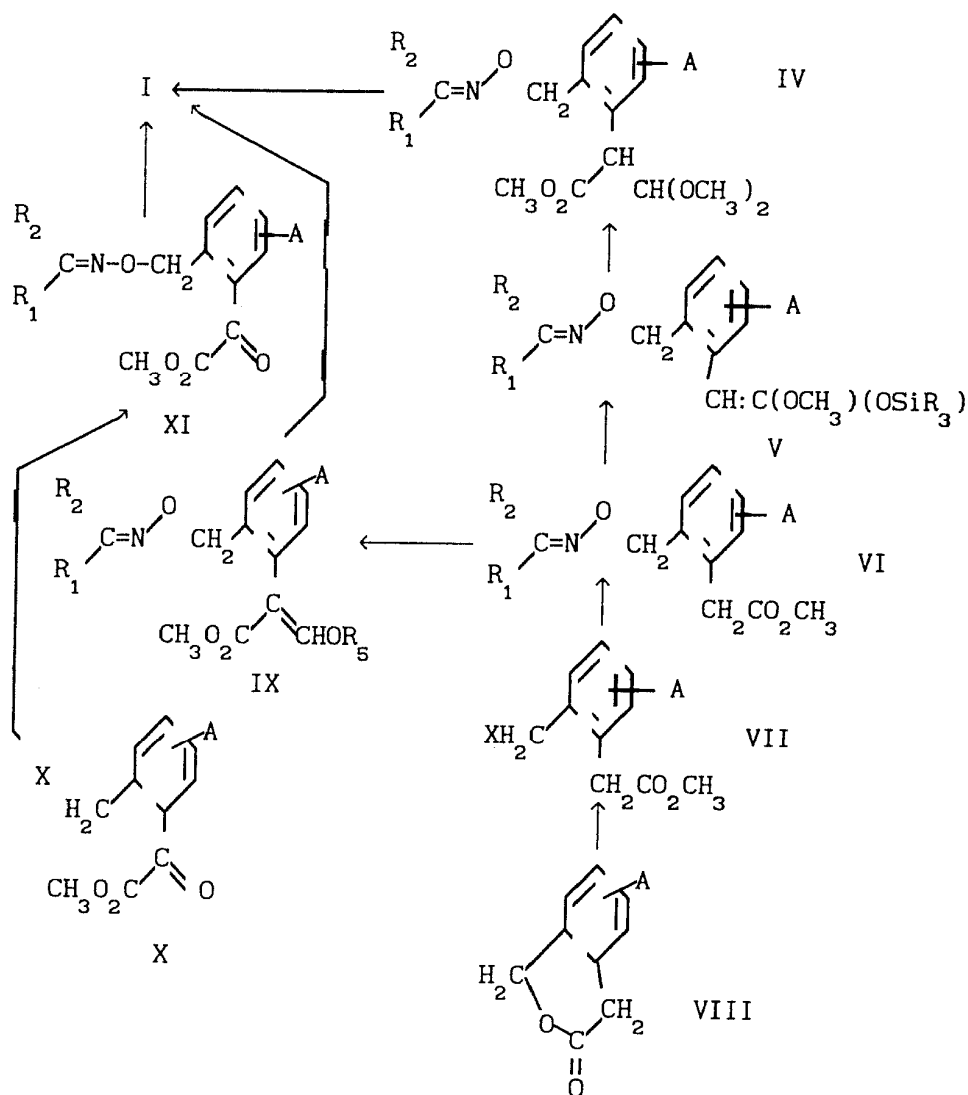
Ацетали формулы IV могут быть получены с помощью обработки метил-силил-кетен-ацеталей формулы V, где R представляет собой алкильную группу, триметилортоформатом в присутствии кислоты Льюиса, такой, как четыреххлористый титанг.

Метилсилилкетенацетали формулы V могут получаться из фенилацеталей формулы VI с помощью обработки основанием и триалкилсилил-галогенидом формулы R₃SiCl или R₃SiBr таким, как триметилсилилхлорид, или основанием (таким, как триэтиламин) и триалкилсилилтрифлатом формулы R₃Si-OSO₂CF₃.

Не всегда необходимо выделять промежуточные продукты IV и V, при соответствующих условиях соединения формулы I могут быть получены из фенилацетатов формулы VI в "одном сосуде" при последовательном добавлении подходящих реагентов, перечисленных выше.

Фенилацетаты формулы VII получают из изохроманонов формулы VIII с помощью обработки соединением HX, где X представляет галоген (такой, как бром), в метаноле, данное преобразование может также проводиться в 2 стадии, если изохроманон VIII обрабатывается HX в неспиртовом растворителе, а получающаяся фенилуксусная кислота затем подвергается этерификации с использованием стандартных приемов. Изохроманоны формулы VIII хорошо известны в химической литературе.

Схема 2



Альтернативно, соединения формулы I могут получаться с помощью обработки сложных кето-эфиров формулы XI реагентами метоксиметил-ирования, такими как метоксиметилентрифенил-фосфоран.

Сложные кетоэфиры формулы XI могут быть получены из сложных кетоэфиров формулы X с помощью обработки анионом оксимов общей формулы III, как описано выше.

Соединения изобретения являются активными фунгицидами и могут использоваться для борьбы с одним или более из следующих патогенных организмов: *Pyricularia oryzae* на рисе, *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis* и другие ржавчины на пшенице, *Puccinia hordei*, *Puccinia striiformis* и другие виды ржавчины на ячмене и ржавчины на других культурах, например, кофе, груше, яблоне, земляном орехе, овощах и декоративных растениях, *Erysiphe graminis* (мучнистая роса) на ячмене и пшенице, и другие виды мучнистой росы на различных культурах, такие, как *Sphaerotheca mammaris* на хмеле, *Sphaerotheca fuliginea* на огуречных (например, огурцах), *Podosphaera leucotricha* на яблоне и *Uncinula necator* на виноградной лозе. *Helminthosporium* spp., *Rhynchosporium* spp., *Septoria* spp., *Pyrenophora* spp., *Pseudocercospora herpotrichoides* и *Gaeumannomyces graminis* на зерновых. *Cercospora arachidicola* и *Cercosporidium personata* на земляном орехе и другие виды *Cercospora* на других культурах, например сахарной свекле, бананах, соевых бобах и рисе. *Botrytis cinerea* (серая плесень) на томатах, клубнике, овощах, винограде и других культурах. *Alternaria* spp. на овощах (например, огурцах), масличном рапсе, яблоке, томатах и других культурах. *Venturia inaequalis* (парша) на яблоне. *Plasmopara viticola* на винограде.

Другие виды мучнистой росы, такие как *Bremia lactucae* на салате, *Peronospora* spp. на соевых бобах, табаке, луке и других культурах, *Pseudoperonospora humuli* на хмеле и *Pseudoperonospora cubensis* на огурцах, *Phytophthora infestans* на картофеле и томатах, и другие *Phytophthora* spp. на овощных культурах, клубнике, авокадо, перце, декоративных культурах, табаке, какао и других культурах. *Thanophorus cucumeris* на рисе и другие виды *Rhizoctonia* на различных культурах, таких как пшеница и ячмень, овощные хлопья и дерн.

Некоторые из соединений показывают широкий спектр активностей против грибов *in vitro*. Они могут также проявлять активность против различных заболеваний фруктов после сбора урожая.

(например, *Penicillium digitatum* и *italicum* и *Tricho-derma viride* на апельсинах, *Gloesporium musarum* на бананах и *Botrytis cinerea* на грейпфруктах).

Кроме того, некоторые из соединений могут быть активными в качестве протравливателей семян против *Tusarium* spp., *Sephoria* spp., *Tilletia* spp. (твердая головня, заболевание пшеницы, возникающее на семенах), *Ustilago* spp. и *Helminthosporium* spp., на зерновых, *Phizoctonia solani* на хлопке и *Pyricularia oryzae* на рисе.

Соединения могут совершать системное движение в растениях. Кроме того, данные соединения могут быть достаточно летучими, чтобы быть активными в паровой фазе против грибков на растениях.

Изобретение следовательно предоставляет способ борьбы с грибками, который предусматривает применение по отношению к растению, семенам растений или к местам распространения растений или семян фунгицидно эффективного количества соединения, определенного выше, или композиции, содержащей эти соединения.

Некоторые из соединений проявляют инсектицидную активность, и при соответствующих нормах расхода или степенях применения могут использоваться для борьбы с рядом насекомых и клещей.

Следовательно, согласно еще одному аспекту изобретения предоставляется способ уничтожения или борьбы с насекомыми или клещами, который включает применение по отношению к насекомым или клещам или к местам их нахождения инсектицидно или митицидно эффективного количества соединения, определенного здесь выше, или композиции, содержащей его.

Соединения могут использоваться непосредственно для сельскохозяйственных целей, но более удобно они преобразуются в композиции с использованием носителя или разбавителя. Таким образом, изобретение предоставляет фунгицидные, инсектицидные и митицидные композиции, включающие соединения, определенные ранее, и приемлемый носитель или разбавитель для них.

Соединения могут применяться с помощью ряда способов. Например, они могут применяться преобразованными или непреобразованными в готовые препаративные формы, непосредственно к листьям растений, к семенам или к иной среде, в которой произрастают растения, или предназначены для посадки, или они могут применяться путем опрыскивания или распыления, или могут применяться в виде препаративной формы в виде крема или пасты, или они могут применяться в виде пара или в виде медленно высвобождающих активный ингредиент гранул.

Применение может осуществляться по отношению к любой части растения, включая листья, стебли, ветви или корни, или к почве, окружающей корни, или по отношению к семенам перед их посадкой, или вообще к почве, к поливной воде или к системе гидропонной культуры. Соединения изобретения могут также вливаются в растения или распыляться на растительность с использованием электродинамических распыляющих устройств или других методов применения низких объемов.

Кроме того, фунгицидный способ изобретения предусматривает предохранительную, защитную, профилактическую и лечебную обработку.

Соединения предпочтительно используются для сельскохозяйственных и садовых целей в виде композиции. Тип используемой композиции в любом случае зависит от конкретной цели, для которой она предназначена.

Композиции могут быть в виде распыляемых порошков или гранул, включающих активный ингредиент (соединение изобретения) и твердый разбавитель или носитель, например, наполнители, такие, как каолин, бентонит, кизельгур, доломит, карбонат кальция, тальк, порошкообразную магнезию, фуллеровку, землю, гипс, диатомитную землю и китайскую глину. Такие гранулы могут быть предварительно сформированными гранулами, подходящими для применения к почве без дополнительной обработки. Эти гранулы могут изготавливаться или с помощью импрегнирования таблеток наполнителя активным ингредиентом, или с помощью таблетирования смеси активного ингредиента и порошкообразного наполнителя. Композиции для протравливания семян могут включать агент (например минеральное масло) для облегчения адгезии композиции к семенам, альтернативно активный ингредиент может преобразовываться в препаративную форму для целей протравливания семян с использованием органического растворителя (например, метилпирролидона, пропиленгликоля или диметилформамида). Композиции могут также быть в виде смачиваемых порошков или диспергируемых в воде гранул, включающих смачивающий или диспергирующий агенты для облегчения диспергирования в жидкостях. Порошки и гранулы могут также содержать наполнители и суспендирующие агенты.

Эмульгируемые концентраты или эмульсии могут приготавливаться с помощью растворения активного ингредиента в органическом растворителе, не обязательно содержащем смачивающий или эмульгирующий агент, а затем добавления смеси к воде, которая также может содержать смачивающий или эмульгирующий агент. Подходящими органическими растворителями являются ароматические растворители такие, как алкилбензолы и алкилнафталины, кетоны, такие, как изофорон, циклогексанон и метилциклогексанон, хлорированные углеводороды, как бензиловый спирт, фурфуроловый спирт, бутанол и простые гликолевые эфиры.

Суспензионные концентраты крупных нерастворимых твердых веществ могут приготавливаться с помощью измельчения на шаровой мельнице или гранулирующей мельнице с диспергирующим агентом, с суспендирующим агентом, который включается для предотвращения осаждения твердого вещества (слеживания).

Композиции, используемые в виде спреев, могут быть в виде аэрозолей, в которых препаративная форма содержится в контейнере под давлением пропеллента (реактивного агента), например, фтортрихлорметана или дихлордифторметана.

Соединения изобретения могут смешиваться в сухом состоянии с пиротехнической смесью для образования композиции, подходящей для генерации в закрытых пространствах дыма, содержащего соединения.

Альтернативно, соединения могут использоваться в микроинкапсулированной форме. Они могут также формулироваться в биоразлагаемых полимерных оболочках для получения медленно-го, регулируемого высвобождения активного вещества.

С помощью включения подходящих добавок, например добавок для улучшения распределения, адгезивной силы и стойкости к дождю на обработанных поверхностях, различные композиции могут лучше приспособливаться для разнообразных областей применения.

Соединения изобретения могут использоваться в виде смесей с удобрениями (например, азот-, калий- или фосфорсодержащими удобрениями). Композиции, включающие только гранулы удобрения, содержащего соединения, например, в виде покрытия, являются предпочтительными. Такие гранулы подходящим образом содержат до 25% по массе соединения. Изобретение, следовательно, представляет также композиции удобрения, включающие удобрение и соединение общей формулы (I) или его соль или металлический комплекс.

Смачиваемые порошки, эмульгируемые концентраты и суспензионные концентраты обычно содержат поверхностно-активные вещества, например, смачивающие агенты, диспергирующие агенты, эмульгирующие агенты или суспендирующие агенты. Эти агенты могут быть катионными, анионными или неионными агентами.

Подходящими катионными агентами являются четвертичные аммониевые соединения, например, цетилтриметиламмонийбромид. Подходящими анионными агентами являются мыла, соли алифатических сложных моноэфиров серной кислоты (например лаурил сульфат натрия), соли сульфированных ароматических соединений (например додецилбензолсульфонат натрия, лигно-сульфонат натрия, кальция или аммония, бутил-нафталинсульфонат и смесь диизопропил- и триизопропилнафталинсульфонатов натрия).

Подходящими неионными агентами являются продукты конденсации окиси этилена с жирными спиртами, такими, как олеиновый или цетиловый спирт, или с алкилфенолами, такими, как октил- или нонилфенол и октилкрезол. Другими неионными агентами являются частичные сложные эфиры, являющиеся производными жирных кислот с длинной цепью и гекситолангидридов, продукты конденсации указанных частичных сложных эфиров с окисью этилена, и лецитины. Подходящими суспендирующими агентами являются гидрофильные коллоиды (например, поливинил пирролидон и натриевая карбоксиметилцеллюлоза), и набухающие глины, такие как бентонит или атта-пульгит.

Композиции для использования в виде водных дисперсий или эмульсий обычно поставляются в виде концентрата, содержащего большое количество активного ингредиента, при этом, концентрат разбавляется перед использованием, водой. Эти концентраты предпочтительно должны быть способны выдерживать хранение в течение продолжительных периодов, а после такого хранения должны быть способны разбавляться водой для того, чтобы давать водные препараты, которые остаются гомогенными в течение достаточного времени, чтобы давать возможность им применяться с помощью обычного оборудования для опрыскивания или распыления. Концентраты могут содержать удобным образом до 95%, предпочтительно 10-85%, например, 25-60% по массе активного ингредиента. После разбавления для образования водных препаратов, такие препараты могут содержать варьирующиеся количества активного ингредиента в зависимости от предназначенной цели, но могут использоваться водные препараты, содержащие 0,0005 или 0,01-10% по массе активного ингредиента.

Композиции изобретения могут содержать другие соединения, обладающие биологической активностью, например соединения, имеющие аналогичную или комплементарную фунгицидную активность, или которые обладают активностью регулировать рост растений, гербицидной или инсектицидной активностью.

Фунгицидным соединением, которое может присутствовать в композиции изобретения, может быть соединение, которое способно подавлять заболевание колосьев злаковых (например, пшеницы), такое как *Septoria*, *Giberella* и *Helminthosporium* spp., заболевания семян и заболевания, возникающие в почве, и ложная мучнистая роса и настоящая роса на винограде, и мучнистая роса и парша на яблоне и др. При включении еще одного фунгицида композиция может иметь более широкий спектр активности, чем одно соединение общей формулы (I). Кроме того, другой фунгицид может оказывать синергистическое действие на фунгицидную активность соединения общей формулы (I). Примерами фунгицидных соединений, которые могут включаться в композиции изобретения, являются (+)-2-(2,4-дихлорфенил)-3-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)пропил 1,1,2,2-тетрафторэтиловый эфир, (RS)-1-аминопропилфосфоновая кислота, (RS)-4-(4-хлорфенил)-2-фенил-2-(1H)-1H, 1,2,4-триазол-1-илметил)бутиронитрил, (RS)-4-хлор-N-(циано)этокси(метил)-бензамид, (Z)-N-бут-2-енил-оксиметил-2-хлор-2,6-диэтилацетанилид, 1-(2-циано-2-метоксииминоацетил)-3-этил мочевины, 1-(2RS, 4RS, 2RS, 4RS)-4-бром-2-(2,4-дихлорфенил)тетрагидрофурурил)-1H-1,2,4-триазол, 3-(2,4-дихлорфенил)(2-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)хинахолин-4(3H)-он, 3-хлор-4-(4-метил-2-(1H-1,2,4-триазол-1-метил)-1,3-диоксолан-2-ил(фенил-4-хлорфенило-вый эфир, 4-бром-2-циано-N,N-диметил-6-трифторметилбензимидазол-1-сульфонамид, 4-хлор-бензол-N-(2,4-дихлорфенил)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)тиоацетамид, 5-этил-5,8-дигидро-8-оксо-(1,3)-диоксолон(4,5-г)хинолин-7-карбоновая кислота, α -(N-(3-хлор-2,6-ксилил)-2-метоксиацетамидо)- γ -бутиролактон, аналазин, BAS 454, беналаксил, беномил, билосазол, бинапакрил, битератанол, блас-тицидин, бупиримат, бутиобат, каптафол, каптан, карбендазим, карбоксин, хлорбензтиазол, хлоро-неб, хлороталонил, хлорозолинат, медьсодержащие соединения, такие как хлорокись меди, сульфат меди в бордоская

смесь, циклогексими́д, ци-моксанил, ципроконал, ципрофурам, ди-2-пиридил дисульфид, 1,1-диоксид, дихлорланид, дихлор, дихлобутразол, дикломезин, диклоран, димет-аморф, диметиримол, диниконазол, динокап, ди-тали́мфос, дитианон, додеморф, додин, эдифен-фос, этаконазол, этиримол, этил (Z)-N бензил-N-(метил-(метилтиозилидениаминооксикарбонил)-амино/тио)-β-алани́нат, этридазол, фенапанил, фенаримол, фенфурам, фенциклонил, фенпропи-дин, фенпропиморф, фентинг-ацетат, фентинг-др-оксид, флутоланин, флутриафол, флузилазол, фолпет, фосэти́лалюминий, фуберидазол, фура́л-аксил, фурконазол-цис, гуазатин, гексаконазол, гидроксизоксазол, имаза́лид, ипробенфос, ипро-дион, изопропиолан, касугамицин, манкоце́б, ма-неб, мепронил, металаксил, метфлу́роксам, мет-сульфовакс, миклобутанил, неоазоцин, диметил-дитиокарбамат никеля, нитротал-изопропил, нуа-римол офурак, ртуть-органические соединения, оксади́ксил, оксика́рбоксин, пенконазол, пенцику-рон, пент-4-енил-N-фу́рфурил-N-имида́зол-1-ил-карбонил-DL-гомоалани́нат, окись феназина, фта-лид: полксин-L, полирам, пробеназол, прохлораз, процимидон, пропамокарб, пропиконазол, пропи-аеб, протиокарб, пиразофос, пирифенос, пиро-хилон, пироксифур, пирро́лнитрин, пи́рролнитро́н, хи́нометио́нат, хинто́зен, стрептоми́цин, се́ра, техно́фталам, тек-на́зен, тебукона́зол, тиабенда́зол, тиофана́тмети́л, тира́м, толкло́фос-мети́л, триа́цетатная соль 1,1-иминоди(октамети́лен)дигуани́дин, триа́дифе́фон, триа́дифе́но́л, триа́збути́л, трици́клазол, триде-морф, трифо́рин, вали́дами́цин А, винкло́золин и цине́б. Соединения общей формулы I могут сме-шиваться с почвой, торфом или другими средами для корневой системы для защиты растений от грибковых заболеваний семян, почвы или листвы.

Подходящие инсектициды, которые могут включаться в композицию изобретения, включают бупрофезин, карбарил, карбофуран, карбосуль-фан, хлорпирифос, циклопротрин, деметон-метил, диазинон, диметоат, этофенпрокс, фенитротрион, фенобукарб, фентион, формотион, изопрокарб, изоксатион, монокротофос, фентоат, пиримикарб, пропафос и ХМС.

Соединениями, регулирующими рост расте-ний, являются соединения, которые подавляют сорняки или селективно подавляют рост менее желательных растений (например, трав).

Примерами подходящих соединений, регули-рующих рост растений, для использования с со-единениями изобретения являются 3,6-дихлор-пиколиновая кислота, 1-(4-хлорфенил)-4,6-димет-ил-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбоновая кис-лота, метил-3,6-дихлорани́зат, абсци́зовая кисло-та, азулам, бензоилпропэтил, карбета́мид, дами-но́зид, дифензо́кват, дикегула́к, эте́фон, фенпен-те́зол, флуорида́мид, глифоса́т, глифоси́н, гидро́к-си́бен зонитри́лы, (например, бромокси́нил), ина-бенфи́д, изопи́римол, жи́рные спирты и кислоты с длинной цепью, малеи́новый гидрази́д, ме́флуи́-дид, морфа́ктины (например, хлорфторэ́кол), пак-лобу́тразол, фено́ксиу́ксусные кислоты (например, 2,4-Д или МСРА), заме́щенная бензо́йная кислота (например, трииодбензо́йная кислота), заме́щенные четверти́чные аммоние́вые и фосфо́ние́вые соединения (например, хлоромеква́тхлорфо́ний или мепиква́тхлори́д), текна́зен, ау́ксины (напри-мер, индо́лу́ксусная кислота, индо́масля́ная кисло-та, нафти́лу́ксусная кислота или нафто́ксиу́ксусная кислота), цитоки́нины (например, бензи́мида́зол, бензи́ладени́н, бензи́ламинопу́рин, дифени́лмоче-вина́ или кинети́н), ги́беррели́ны (например, CA₃, CA₄ или CA₇) и триа́пен те́нол.

Следующие примеры иллюстрируют изобре-тение. На протяжении всех примеров термин "простой эфир или эфир" относится к диэтиловому эфиру, сульфат магния использовался для сушки растворов и растворы концентрировались при по-ниженном давлении. Реакции, в которые вовлече-ны промежуточные продукты, чувствительные к воздуху или воде, проводились в атмосфере азо-та, а растворители перед использованием суши-лись, когда это было необходимо. Если не указано иное хроматография проводилась на колонке из силикагеля в качестве стационарной фазы. Когда это показано, данные ИК-спектров и ЯМР-являются селективными, не делается попытки пе-речислить каждое поглощение во всех случаях ¹H ЯМР спектры регистрировались с использованием CDCl₃-растворов, если не указано иначе. В тексте используются следующие сокращения:

ТГФ = тетрагидрофуран с. = синглет

ДМФ - диметилформамид д. = дублет

ЯМР - ядерномагнитный резонанс т. – триплет

м. – мультиплет

шир. – широкий

НР С - жидкостная хроматография высокой разрешающей способности.

Пример 1. Данный пример иллюстрирует по-лучение (Е), (Е)-метил-3-метокси-2-/2-/3-метил-бензальдоксиминометил-(фенил) пропеноата (со-единения I).

Раствор (Е)-3-метилбензальдоксима (0,23 г) в ДМФ (5 мл) добавлялся по каплям к перемешиваемой суспензии гидрида натрия (0,051 г) в ДМФ (5 мл) при комнатной температуре. Спустя 0,5 ч к реакционной смеси добавлялся раствор (Е)-метил-2-(2-)бромометил(фенил)-3-метоксипропен-оата (0,5 г, полученного по способу, описанному в EP-A-0203606) в ДМФ (5 мл), смесь затем пере-мешивалась при комнатной температуре в тече-ние 4 ч. Смесь выливалась в воду и экстрагирова-лась (×2) простым эфиром. Объединенные экстрак-ты промывались водой, затем сушились, концен-трировались и хроматографировались с исполь-зованием эфира в качестве элюента, давая целе-вое соединение (0,132 г, 23% выход) в виде блед-но-желтого масла. ИК-максимум (пленка): 1709, 1631 см⁻¹. ¹H ЯМР (270 МГц), δ: 2,35 (3H, с), 3,69 (3H, с.), 3,80 (3H, с.), 5,12 (2H, с), 7,1-7,55 (8H, м.), 7,59 (1H, с.), 8,05 (1H, с.) млн. дол.

Пример 2. Данный пример иллюстрирует по-лучение (Е), (Е) и (Z), (Е) смеси метил 2-(2-)3,5-диметилпиразин-2-ил-ацетоксиминометил(фенил)-3-метоксипропеноата (соединение 176).

К смеси 2,6-диметилпиразола (3,24 г), серной кислоты (15 мл 3,4 М раствора) и ацетальдегида (10 мл), перемешиваемой при 0°C, добавлялся одновременно раствор сульфата железа (2) (50,1 г в 150 мл воды) и трет-бутилгидропероксида (16,2 мл 70%-ного водного раствора). Температу-ра во время добавления

поддерживалась ниже 3°C. После добавления реакционная смесь перемешивалась при 0°C в течение 1 ч. Добавлялся метабисульфат натрия до тех пор, пока смесь не давала отрицательный результат крахмал-йод-ного испытания. Реакционная смесь экстрагировалась дихлорметаном, объединенные экстракты промывались водой, затем сушились, концентрировались и хроматографировались с использованием смеси эфира и 60-80°C бензина (4:1) и в качестве элюента, давая 2-ацетил-3,5-диметил-пиразин (2,65 г, 59% выход) в виде бледно-желтого масла. ИК-максимум (пленка): 1694, 1551, 1262, 1175 см⁻¹. ¹H ЯМР (270 МГц) δ: 2,62 (3H, с.), 2,70 (3H, с.), 2,80 (3H, с.), 8,36 (1H, с.) млн. дол.

2-Ацетил-3,5-диметилпиразин (2,65 г), хлор-гидрат гидроксиламина (2,5 г) и тригидрат ацетата натрия (3,5 г) нагревались с обратным холодильником в метаноле (50 мл) в течение 1 ч. Реакционная смесь концентрировалась, разбавлялась водой (75 мл) и экстрагировалась этилацетатом. Объединенные экстракты сушились и концентрировались, давая масло, которое растиралось с эфиром и 60-80°C бензином, давая 3,5-диметил-2-(1-гидроксиминотил)пиразин (2,54 г, 87% выход) в виде белого твердого вещества (т. пл. 85-89°C) и в виде 1:1 смеси (Е) (Z) изомеров. ИК-максимум (пленка): 2925, 1465, 1376, 1086, 930 см⁻¹. ¹H ЯМР (270 МГц) δ: 2,23 (3H, с.), 2,33 (3H, с.), 2,53 (3H, с.), 2,56 (3H, с.), 2,58 (3H, с.), 2,68 (3H, с.), 8,32 (1H, с.), 8,35 (1H, с.), 8,35 (1H, с.), 9,45 (1H, шир. с.), 9,85 (1H, шир. с.) млн. дол.

1: 1 смесь (Е/З)-3,5-диметил-2-(1-гидроксиминотил)пиразина (0,87 г) добавлялась порциями к перемешиваемой суспензии гидроксида натрия (0,25 г) в ДМФ (20 мл) приблизительно при 5°C. Через 1 ч к реакционной смеси при 0°C добавлялся раствор (Е)-метил 2-(2-бромометил(фенил)-3-метоксипропеноата (1,5 г) в ДМФ (5 мл). Через 1,5 ч смесь выливалась в воду и экстрагировалась (×2) эфиром. Объединенные экстракты промывались солевым раствором, затем сушились, концентрировались и хроматографировались с использованием смеси эфир:гексан 1:1 в качестве элюента, давая целевое соединение, смесь оксимных изомеров (главный: второстепенный 7:3), в виде бледно-розового твердого вещества (0,57 г, 30% выход), т. пл. 56-60°C. ИК-максимум (пленка): 1707, 1624, 1132 см⁻¹. ¹H ЯМР (270 МГц) главный изомер - δ: 2,39 (3H, с.), 2,54 (3H, с.), 2,57 (3H, с.), 3,67 (3H, с.), 3,82 (3H, с.), 5,15 (2H, с.), 7,1-7,9 (4H, м.), 7,59 (1H, с.), 8,27 (1H, с.), млн. дол.

Второстепенный изомер - δ: 2,22 (3H, с.), 2,51 (3H, с.), 2,57 (3H, с.), 3,67 (3H, с.), 3,82 (3H, с.), 5,27 (2H, с.), 7,1-7,9 (4H, м.), 7,76 (1H, с.), 8,33 (1H, с.), млн. дол.

Пример 3. Данный пример иллюстрирует получение (Е), (Е)-метил-3-метокси-2-(2-фенил-ацетоксиминотил(фенил)пропеноата (соединение 23).

Раствор ацетофеноноксима (1,23 г) в ДМФ (5 мл) добавлялся по каплям к перемешиваемой суспензии гидроксида натрия (0,367 г) в ДМФ (25 мл). Спустя 1 ч к реакционной смеси добавлялся раствор (Е)-метил 2-(2-бромметил(фенил)-3-метоксипропеноата (2,0 г) в ДМФ (15 мл) и смесь затем перемешивалась при комнатной температуре в течение 16 ч. Смесь выливалась в воду и экстрагировалась (×2) эфиром. Объединенные экстракты промывались водой, затем сушились, концентрировались и хроматографировались с использованием смеси эфир: 40-60, нефть 3:2, давая неочищенное масло. НР С с использованием смеси эфир: 40-60 нефть 1:1 давала целевое соединение (0,55 г, 23% выход) в виде бледно-желтого масла. ИК-максимум (пленка): 1708, 1631 см⁻¹.

Пример 4. Данный пример иллюстрирует получение и разделение (Е), (Е)- и (Z)-изомеров метил-3-метокси-2-(2-) (пиримидин-5-илизопропил-оксимино)-О-метил(фенил)пропеноата (соединения 66 и 67).

Раствор оксима изопропилпиримидин-5-ил-кетона (0,29 г 3:2 смеси (Е)-: (Z)-изомеров) в ДМФ (5 мл) добавлялся к перемешиваемой суспензии гидроксида натрия (0,09 г) в ДМФ (10 мл). Спустя 2 ч смесь охлаждалась до 0°C, и к реакционной смеси добавлялся раствор (Е)-метил 2-(2-) бромметил(фенил)-3-метоксипропеноата (0,5 г) в ДМФ (5 мл), и смесь перемешивалась в течение 3 ч. Смесь выливалась в воду и экстрагировалась простым эфиром. Объединенные экстракты промывались водой, затем сушились и концентрировались, давая масло, неочищенную смесь (Е), (Е)- и (Z), (Е)-изомеров. Для разделения этих изомеров на их два компонента использовалась НР С с использованием эфира в качестве элюента: 1. Более быстро элюирующая фракция - (Z) -оксимный эфир, (Е)-пропеноат. (0,115 г, 18% выход). Прозрачное масло, (соединение 67). 2. Более медленно элюирующаяся фракция - (Е)-оксимный эфир, (Е)-пропеноат (0,098 г 15% выход). Прозрачное масло (соединение 66).

Пример 5. Данный пример иллюстрирует получение одного стереоизомера метил 2-(2-фенил(метилтио)оксиминометил(фенил)-3-метоксипропеноата (соединение 191).

Раствор хлора (1,5 г) в четыреххлористом углеороде (42 мл) добавлялся порциями к перемешиваемому частичному раствору бензальдегидоксима (2,5 г, ¹H ЯМР: δ 8,18 (1H, с.), 9,40 (1H, шир. с.) млн. дол. в четыреххлористом углеороде (20 мл) при комнатной температуре. После добавления реакционная смесь перемешивалась при комнатной температуре в течение 3 ч, затем выливалась в воду. Органический слой отделялся, сушился и концентрировался, давая почти чистый α-хлорбензальдегидоксим (3,2 г) в виде желтой жидкости. Раствор метантиолата натрия (0,68 г) в метаноле (15 мл) добавлялся по каплям к охлаждаемому льдом и перемешиваемому раствору части данного α-хлорбензальдегидоксима (1,5 г) в метаноле (15 мл). После добавления реакционная смесь перемешивалась в течение 2 ч при непрерывном охлаждении в ледяной воде. Метанол удалялся при пониженном давлении, и остаток хроматографировался с использованием дихлор-метана в качестве элюента, давая единственный стереоизомер α-метилтиобензальдегид-оксима (0,670 г, выход 42%) в виде белого кристаллического твердого вещества, т. пл. 76-78°C, ¹H ЯМР: δ 2,08 (3H, с.), 9,12 (1H, с.) млн. дол.

Раствор - метилтиобензальдегидоксима (0,575 г) в ДМФ (10 мл) добавлялся по каплям к перемешиваемой суспензии гидроксида натрия (85 г) в ДМФ (16 мл) при комнатной температуре. Через час по каплям добавлялся раствор (Е)-метил-2-

(2-)бром-метил(фенил)-3-метоксипропеноата (0,990 г), в ДМФ и спустя еще 3 ч смесь выливалась в воду и экстрагировалась этилацетатом. Ор-ганические экстракты промывались водой, суши-лись, концентрировались и хроматографиро-вались с использованием увеличивающихся коли-честв этилцетата в гексане и качестве элюента, давая целевое соединение (1,05 г, 83%) в виде бесцветного масла, ИК: 1706 см^{-1} .

Пример 6. Данный пример иллюстрирует по-лучение единственных стереоизомеров метил 2-(2-)фенил-(метилсульфинил)оксиминометил (фе-нил)-3-метоксипропеноата и метил 2-(2-)фе-нил(метилсульфонил)оксииминометил)-фенил-3-метоксипропеноата (соединения 227 и 228). м-Хлорнадбензойная кислота (0,250 г, содержащая 45% м-хлорбензойную кислоту) добавлялась пор-циями в течение 30 мин к перемешиваемому рас-твору метил 2-(2-)фенил (метилтио)оксимино-метил(фенил)-3-метоксипропеноата (0,300 г, по-лученного, как описано в примере 5 в дихлорме-тане (20 мл), охлажденного в ледяной воде. Еще через 15 мин реакционная смесь промывалась по-следовательно водным бикарбонатом натрия и во-дой, затем сушилась, концентрировалась и хро-матофафировалась с использованием 1:1 смеси этилацетата и гексана в качестве элюента, давая целевые соединения: (I) сульфон, элюируемый пе-рвым, в виде смолы (0,090 г, выход 28%), и (II) сульфоксид, также смола (0,150 г, выход 48%).

Пример 7. Данный пример иллюстрирует по-лучение двух стереоизомеров метил-2-(2-фенил/метокси)оксииминометил (фенил)-3-меток-сипропеноата (соединения 225 и 226).

Смесь стереоизомеров α -метоксибензальде-гидоксима приготавливалась в 2 стадии из метил-бензоата с помощью последовательной обработки реагентом Lawessonia и гидроксилamina (см., на-пример EP 0299382). Стереоизомеры разделялись с помощью хроматографии с использованием ди-хлорметана в качестве элюента. (I) Изомер А элюируемый первым, бледно-желтое твердое ве-щество, т. пл. 55-57°C, ^1H ЯМР: δ 3,83 (3H, с.), 7,72 (1H, с.) млн. дол. и (II) Изомер В, бесцветная смо-ла. ^1H ЯМР: δ 3,96 (3H, с.), 8,84(1H, с.) млн. дол.

Эти 2 стереоизомерных оксима превращались по отдельности в целевые соединения по способу, описанному в примере 5, то есть с помощью по-следовательной обработки гидридом натрия и (Е)-метил 2-(2-)бромметил(фенил)-3-метоксипропе-ноатом. Изомер А дал целевое соединение № 225 табл. 1 в виде смолы: изомер В дал целевое со-единение № 226 табл. 1, также в виде смолы (ка-меди).

Ниже следуют примеры композиций, подхо-дящих для сельскохозяйственной цели и в садовод-стве, которые могут получаться из соединений изобретения. Такие композиции образуют еще один аспект изобретения. Процентное содержание дано по массе.

Пример 8. Эмульгируемый концентрат приго-тавливается с помощью смешения и перемешива-ния ингредиентов до тех пор, пока они не раство-ряются. Соединение 45 10% Бензиловый спирт 30% Додecilбензолсульфонат кальция 5% Нонилфен-олэтоксилат (13 моль окиси этилена) 10% алкил-бензолы 45%.

Пример 9. Активный ингредиент растворяется в метилендихлориде и полученная жидкость рас-пылялась на гранулы из аттапульгитной шины. Растворителю затем давали возможность испа-риться для получения гранулярной композиции. Соединение 45 5% Аттапульгитные гранулы 95%.

Пример 10. Композиция, пригодная для ис-пользования в качестве протравливателя семян, приготавливается с помощью измельчения и сме-шения трех ингредиентов. Соединения 45 50% Минеральное масло 2% Китайская глина 48%.

Пример 11. Распыляемый порошок приготавливается с помощью измельчения и смешения ак-тивного ингредиента с тальком. Соединение 45 5% Тальк 95%

Пример 12. Суспензионный концентрат приго-тавливается с помощью измельчения на шаровой мельнице ингредиентов с образованием водной суспензии измельченной смеси с водой. Соедине-ние 45 40% Лигносульфонат натрия 10% Бенто-нитная глина 1% Вода 49%.

Данная препаративная форма может исполь-зоваться в виде спрея при разбавлении водой или применяться непосредственно по отношению к семенам.

Пример 13. Препаративная форма в виде сма-чиваемого порошка изготавливается с помощью смешения вместе с измельчением ингредиентов до тех пор, пока все они не смешаются тща-тельно. Соединение 45 25% Лаурилсульфат натрия 2% Лигносульфонат натрия 5% Двуокись кремния 25% Китайская глина 43%.

Пример 14. Соединения испытывались против различных грибковых заболеваний листьвы расте-ний. Применялся следующий прием.

Растения выращивались в компосте для горш-ков John Annes (1 или 2) в минигоршочках диамет-ров 4 см. Испытываемые соединения преобразо-вывались в готовую препаративную форму или путем измельчения с применением гранулятора с водным дисперзолом Т, или в виде раствора в ацетоне или смеси ацетон/этанол, которая раз-бавлялась до требуемой концентрации непо-средственно перед использованием. В случае за-болеваний листьвы препаративные формы (100 част./млн. активного ингредиента) распыля-лись на листьву или применялись по отношению к корням растений в почве. Препараты для распы-ления (спрей) применялись для максимального удержания на поверхности и смачивания корней до конечной концентрации эквивалентной прибли-зительно 40 част./млн. активного ингредиента в сухой почве. Когда спрей применялся по отноше-нию к злаковым, добавлялся Твин 20 для полуече-ния окончательной концентрации 0,05%.

Для большинства испытаний соединение при-менялось к почве (корням) и к листьве (путем оп-рыскивания) за один или два дня до того, как рас-тение инокулируется заболеванием. Исключением было испытание на *Erysiphe graminis*, при котором растения инокулировались за 24 ч до обработки. Лиственные

патогенные организмы применялись путем опрыскивания суспензиями спор листьев испытываемых растений. После инокуляции растения помещались в соответствующую окружающую среду для того, чтобы позволить инфекции развиваться, а затем инкубировались до тех пор, пока заболевание не будет готово для оценки. Период времени между инокуляцией и оценкой варьировал от 4 до 14 дней в зависимости от заболевания и окружающей среды.

Подавление заболевания регистрировалось в соответствии со следующей шкалой: 4 = отсутствие заболевания, 3 = следы - 5% заболевания на необработанных растениях, 2 = 6-25% заболевания на необработанных растениях, 1 = 26-59% заболевания на необработанных растениях, 0 = 60-100% заболевания на необработанных растениях.

Результаты показаны в табл. 5-6.

Пример 15. Инсектицидные свойства соединения формулы (I) демонстрировались следующим образом.

Активность соединения определялась с использованием разнообразных насекомых, клещей и нематод. За исключением случая активности "нокдаун" против *Musca Domestica*, для которого процедура испытания описывается позднее, соединение использовалось в виде жидких препаратов, содержащих $12,5-1000 \text{ млн}^{-1}$ по массе соединения. Препараты приготавливались путем растворения соединения в ацетоне и разбавления растворов водой, содержащей 0,1% по массе смазывающего агента, продаваемого под торговым наименованием "СИНПЕРОНИК" ПХ, до тех пор, пока жидкие препараты не будут содержать требуемую концентрацию продукта. "СИНПЕРОНИК" является зарегистрированной торговой маркой.

Процедура испытания, применяемая в отношении каждого паразитического организма, была в основном одной и той же и включала нанесение ряда вредных организмов на среду, которой обычно было растение-хозяин или корм, которым питаются вредители, и обработку препаратом или вредителей или среды, или и вредителей и среды. Смертность вредителей затем оценивалась с промежутками времени от одного до семи дней после обработки.

Результаты испытаний показаны в табл. 7-8 для каждого из соединений, указанных в первой колонке, и с расходом в частях на миллион, данных во второй колонке. Они показаны в виде степени смертности, обозначаемой как 9, 5 или 0, где 9 указывает на 80-100% смертность (70-100% уменьшение корневых наростов по сравнению с необработанными растениями для испытания полу ин витро с *Meloidogyne incognita*, 5 указывает на 50-79% смертность (50-69% уменьшение корневых наростов для испытания полу ин витро с *Meloidogyne incognita* и 0 обозначает менее, чем 50% смертность.

В табл. 7-8 используемые вредители обозначаются буквенным кодом. Значение кода, среда-носитель или корм, и тип и продолжительность испытания приводятся в табл. 9.

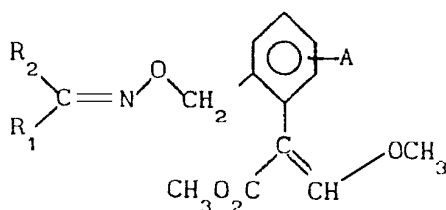
Свойства вызывать "нокдаун" в отношении *Musca domestica* демонстрировались следующим образом.

Образец соединения разбавлялся в 0,1% смеси этанол/ацетон (смесь 50:50) и доводился до раствора 1000 млн^{-1} с помощью 0,1%-ного водного раствора СИНПЕРОНИК ПХ. Раствор (1 мл) затем распылялся непосредственно на мух смешанного пола, содержащихся в чашке для питья, содержащей кусочек сахара, который также опрыскивался.

Сразу же после опрыскивания чашки переворачивались и оставлялись сохнуть. Оценка нокдауна производилась через 15 мин, когда чашки опять были повернуты в правильное положение. Затем перед тем, как производить оценку смертности, мух накрывали влажным ватным тампоном и содержали в течение 48 ч в помещении, в котором поддерживались условия: 25°C и относительная влажность 65%.

Таким образом, предложенные соединения обладают более высокой фунгицидной активностью и могут быть использованы в сельском хозяйстве.

Таблица 1



Соединение №	R ¹	R ²	A	Оксим*	Олефиновый ⁺	Т. пл. °С	Соотношение изомеров ⁺⁺
1	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄	H	H	8,50	7,60	масло	
2	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄	H	H	8,50	7,60	масло	
3	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	H	H				
4	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	H				
5	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	H	8,05	7,59	масло	
6	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	H	8,07	7,60	масло	19:1
7	2-F-C ₆ H ₄	H	H				
8	3-F-C ₆ H ₄	H	H				
9	4-F-C ₆ H ₄	H	H				
10	2-Cl-C ₆ H ₄	H	H				
11	3-Cl-C ₆ H ₄	H	H	8,04	7,59	масло	

Продолжение табл. 1

Соединение №	R ¹	R ²	A	Оксим*	Олефиновый ⁺	Т. пл. °С	Соотношение изомеров ⁺⁺
12	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H				
13	2-Br-C ₆ H ₄	H	H				
14	3-Br-C ₆ H ₄	H	H				
15	4-Br-C ₆ H ₄	H	H				
16	2-NO ₂ -C ₆ H ₄	H	H				
17	3-NO ₂ -C ₆ H ₄	H	H	8,14	7,61	масло	
18	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	H	H				
19	2-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	H				
20	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	H	8,12	7,60	масло	
21	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	H				
22	C ₆ H ₅	H	H	8,10	7,60	63-6	
23	C ₆ H ₅	CH ₃	H		7,59	масло	
24	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H				
25	2-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄	H	H				
26	3-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄	H	H				
27	4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄	H	H				
28	2-(C ₆ H ₅ CH ₂ O)-C ₆ H ₄	H	H				
29	3-(C ₆ H ₅ CH ₂ O)-C ₆ H ₄	H	H	8,06	7,60	масло	
30	4-(C ₆ H ₅ CH ₂ O)-C ₆ H ₄	H	H				
31	2-циано-C ₆ H ₄	H	H				
32	3-циано-C ₆ H ₄	H	H	8,07	7,60	масло	
33	4-циано-C ₆ H ₄	H	H				
34	2-CF ₃ O-C ₆ H ₄	H	H				
35	3-CF ₃ O-C ₆ H ₄	H	H				
36	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄	H	H				
37	пирид-2-ил	H	H	8,19	7,60	масло	
38	пирид-3-ил	H	H	8,10	7,60	масло	
39	пирид-4-ил	H	H	8,03	7,61	110,5-111,5	
40	пирид-2-ил	CH ₃	H		7,60	масло	
41	пирид-2-ил	циано	H		7,63	144-6	
42	пирид-2-ил	CO ₂ C ₂ H ₅	H		7,56	масло	
43	пирид-2-ил	CO ₂ CH ₃	H				
44	пиримидин-2-ил	H	H				
45	пиримидин-4-ил	H	H	8,07	7,61	96-9	

Соединение №	R ¹	R ²	A	Олефин ⁺	Т.пл. °C	Соотношение изомеров
46	тиен-2-ил	H	H			
47	тиен-2-ил	CH ₃	H	7,58	масло	16:1
48	5-Cl-тиен-2-ил	H	H			
49	CO ₂ C ₂ H ₅	CO ₂ C ₂ H ₅	H	7,58	масло	
50	CO ₂ CH ₃	CO ₂ CH ₃	H			
51	COCH ₃	COCH ₃	H			
52	циано	циано	H			
53	Ø	Ø	H			
54	Ø	Ø	H			
55	Ø	Ø	H	7,58	масло	
56	трет-С ₄ H ₉	H	H			
57	C ₆ H ₅ CH ₂	H	H			
58	2,4-ди-Cl-C ₆ H ₃	H	H			
59	2,4-ди-F-C ₆ H ₃	H	H			
60	3,5-ди-CH ₃ -C ₆ H ₃	H	H			
61	3,5-ди-CH ₃ O-C ₆ H ₃	H	H			
62	пиразин-2-ил	CH ₃	H	7,61	116-118,5	
63	6-CH ₃ -пирид-3-ил	CH ₃	H	7,60	67-73	

Продолжение табл. 1

Соединение №	R ¹	R ²	A	Олефин ⁺	Т.пл. °C	Соотношение изомеров ⁺⁺
64	пирид-2-ил	C ₂ H ₅	H	7,60	70-80	
65	пирид-3-ил	CH ₃	H	7,60	масло	24:1
66	пиримидин-5-ил	изо-C ₃ H ₇	H	7,60	масло	
67	изо-C ₃ H ₇	пиримидин-5-ил	H	7,53	масло	
68	пирид-4-ил	CH ₃	H			
69	6-Cl-пирид-2-ил	CH ₃	H			
70	5-Cl-пирид-2-ил	CH ₃	H			
71	4-Cl-пирид-2-ил	CH ₃	H			
72	3-Cl-пирид-2-ил	CH ₃	H			
73	6-циано-пирид-2-ил	CH ₃	H			
74	5-циано-пирид-2-ил	CH ₃	H			
75	4-циано-пирид-2-ил	CH ₃	H	7,61	98-99	
76	3-циано-пирид-2-ил	CH ₃	H			
77	6-Br-пирид-2-ил	CH ₃	H			
78	5-Br-пирид-2-ил	CH ₃	H			
79	4-Br-пирид-2-ил	CH ₃	H			
80	3-Br-пирид-2-ил	CH ₃	H			
81	6-CH ₃ -пирид-2-ил	CH ₃	H			
82	5-CH ₃ -пирид-2-ил	CH ₃	H			
83	4-CH ₃ -пирид-2-ил	CH ₃	H			
84	3-CH ₃ -пирид-2-ил	CH ₃	H			
85	6-F-пирид-2-ил	CH ₃	H			
86	5-F-пирид-2-ил	CH ₃	H			
87	4-F-пирид-2-ил	CH ₃	H			
88	3-F-пирид-2-ил	CH ₃	H			
89	3-CH ₃ -пиразин-2-ил	CH ₃	H	7,60	106-8	
90	3-C ₂ H ₅ -пиразин-2-ил	CH ₃	H	7,59	74-76,5	
91	3-Cl-пиразин-2-ил	CH ₃	H			
92	3-OCH ₃ -пиразин-2-ил	CH ₃	H	7,58	масло	
93	5-CO ₂ CH ₃ -пиразин-2-ил	CH ₃	H	7,60	масло	4:1
94	5-CO ₂ C ₂ H ₅ -пиразин-2-ил	CH ₃	H			
95	3-циано-пиразин-2-ил	CH ₃	H			
96	пиримидин-4-ил	CH ₃	H			
97	2-Cl-пиримидин-4-ил	CH ₃	H			
98	2-OCH ₃ -пиримидин-4-ил	CH ₃	H			

	ил					
99	2-CH ₃ -пиримидин-4-ил	CH ₃	H			
100	2-циано-пиримидин-4-ил	CH ₃	H			
101	тиазол-2-ил	CH ₃	H	7,60	107-114	10:1
102	тиен-3-ил	CH ₃	H	7,60	масло	
103	5-Cl-тиен-2-ил	CH ₃	H			
104	5-CH ₃ -тиен-2-ил	CH ₃	H			
105	5-Br-тиен-2-ил	CH ₃	H			
106	5-циано-тиен-2-ил	CH ₃	H			
107	3-CH ₃ -тиен-2-ил	CH ₃	H			
108	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,57	масло	
109	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H			
110	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,57	85-7	
111	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,58	масло	
112	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,58	масло	
113	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,58	масло	
114	2-F-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,59	масло	
115	3-F-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,60	масло	
116	4-F-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,59	масло	

Продолжение табл. 1

Соединение №	R ¹	R ²	A	Олефин ⁺	Т.пл. °C	Соотношение изомеров ⁺⁺
117	2-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	H			
118	3-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,59	масло	
119	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	H			
120	2-Br-C ₆ H ₄	CH ₃	H			
121	3-Br-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,59	масло	
122	4-Br-C ₆ H ₄	CH ₃	H			
123	2-NO ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,59	70-72	
124	3-NO ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	H			
125	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,60	100-2	
126	2-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H			
127	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,60	масло	
128	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H			
129	2-циано-C ₆ H ₄	CH ₃	H			
130	3-циано-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,60	75,5-77	
131	4-циано-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,59	масло	
132	3,4,5-(OCH ₃) ₃ -C ₆ H ₂	CH ₃	H			
133	3,5-di-F-пирид-2-ил	CH ₃	H			
134	3,4,5,6-F ₄ -пирид-2-ил	CH ₃	H			
135	2,6-di-Cl-пирид-3-ил	CH ₃	H			
136	пиридазин-3-ил	CH ₃	H			
137	пиридазин-4-ил	CH ₃	H			
138	6-CH ₃ -пиридазин-3-ил	CH ₃	H			
139	4-циано-хинолин-2-ил	CH ₃	H	7,63	160,5-162	
140	хиноксалин-2-ил	CH ₃	H	7,62	179-181	
141	C ₆ H ₅	CH ₃	6-F			
142	C ₆ H ₅	CH ₃	6-Cl			
143	6-CH ₃ -пиримидин-4-ил	CH ₃	H	7,60	масло	4:1
144	4-CH ₃ -пиримидин-5-ил	CH ₃	H	7,58	масло	6:1
145	4-CH ₃ -пиримидин-2-ил	CH ₃	H	7,57	масло	
146	4,6-ди-CH ₃ -пиримидин-2-ил	CH ₃	H			
147	2,6-ди-CH ₃ -пиримидин-4-ил	CH ₃	H			
148	2,4-ди-CH ₃ -пиримидин-5-ил	CH ₃	H			
149	6-Cl-пиримидин-4-ил	CH ₃	H			
150	6-OCH ₃ -пиримидин-4-ил	CH ₃	H			
151	4,6-ди-OCH ₃ -пиримидин-2-ил	CH ₃	H			

152	Ø	Ø	H	7,58	масло	
153	Ø	Ø	H	7,58	109-110	
154	N-оксид-пирид-2-ил	CH ₃	H	7,52	масло	
155	5-C ₂ H ₅ -пирид-2-ил	CH ₃	H			
156	CH ₃ CO	CH ₃	H	7,59	78	
157	C ₆ H ₅ CO	CH ₃	H	7,56	55	
158	N-CH ₃ -пиррол-2-ил	CH ₃	H	7,57	масло	
159	4-Cl-хинолин-2-ил	CH ₃	H	7,62	114-116	
160	2,4-ди-Cl-C ₆ H ₃	1,2,4-триазол-1-ил-CH ₂	H	7,61	Oil	
161	2,4-ди-Cl-C ₆ H ₃	пирид-3-ил-CH ₂	H			
162	2,4-ди-CH ₃ -тиазол-5-ил	CH ₃	H	7,58	Oil	
163	фуран-2-ил	CH ₃	H	7,58	Oil	
164	2,4-ди-CH ₃ -фуран-3-ил	CH ₃	H			
165	пирид-2-ил	пирид-2-ил	H	7,56	Oil	

Продолжение табл. 1

Соединение №	R ¹	R ²	A	Олефин ⁺	Т.пл. °C	Соотношение изомеров ⁺⁺
166	6-C ₆ H ₅ -пиримидин-4-ил	CH ₃	H			
167	4-циано-пирид-3-ил	CH ₃	H			
168	1,2,4-триазин-5-ил	CH ₃	H			
169	3-CH ₃ -1,2,4-триазин-5-ил	CH ₃	H			
170	3-C ₆ H ₅ -1,2,4-триазин-5-ил	CH ₃	H			
171	3-SCH ₃ -1,2,4-триазин-5-ил	CH ₃	H			
172	3-OCH ₃ -1,2,4-триазин-5-ил	CH ₃	H			
173	5-CONH ₂ -пиразин-2-ил	CH ₃	H	7,60	146-8	3:1
174	5-циано-пиразин-2-ил	CH ₃	H	7,62	89-92	
175	5,6-ди-CH ₃ -пиразин-2-ил	CH ₃	H	7,60	114-6	
176	3,5-ди-CH ₃ -пиразин-2-ил	CH ₃	H	7,59	56-60	7:3
177	3,6-ди-CH ₃ -пиразин-2-ил	CH ₃	H	7,59	масло	
178	5-CH ₃ -пиразин-2-ил	CH ₃	H			
179	6-CH ₃ -пиразин-2-ил	CH ₃	H			
180	5-Cl-пиразин-2-ил	CH ₃	H			
181	6-Cl-пиразин-2-ил	CH ₃	H			
182	5,6-дициано-пиразин-2-ил	CH ₃	H			
183	4-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,59	масло	
184	4-NH ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,58	масло	
185	2,4-ди-Cl-C ₆ H ₃	CH ₃	H	7,60	79-82	
186	2,4-ди-CH ₃ -C ₆ H ₃	CH ₃	H	7,57	66-68,5	
187	4-NHCONH ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	H			
188	C ₆ H ₅	циклопропил	H	7,57	масло	8:1
189	C ₆ H ₅	Cl	H			
190	4-C ₂ H ₅ O-C ₆ H ₄	CF ₃	H	7,55	масло	
191	C ₆ H ₅	SCH ₃	H	7,57	масло	
192	C ₆ H ₅	F	H			
193	C ₆ H ₅	OC ₂ H ₅	H			
194	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	7,57	масло	
195	циклогексил-CH ₂	CH ₃	H			
196	C ₆ H ₅ -CH ₂	CH ₃	H	7,57	масло	
197	пиразин-2-ил-CH ₂	CH ₃	H			
198	(E)-C ₆ H ₅ -CH=CH	CH ₃	H	7,58	масло	
199	C ₆ H ₅ -OCH ₂	CH ₃	H			

200	C ₆ H ₅	CH ₂ Cl	H			
201	бензтиазол-2-ил	CH ₃	H			
202	бензоксазол-2-ил	CH ₃	H			
203	пиразин-2-ил	C ₂ H ₅	H			
204	5-OCH ₃ -пиразин-2-ил	CH ₃	H			
205	6-OCH ₃ -пиразин-2-ил	CH ₃	H			
206	6-циано-пиразин-2-ил	CH ₃	H			
207	5-циано-пирид-3-ил	CH ₃	H			
208	6-циано-пирид-3-ил	CH ₃	H			
209	3-циано-пирид-4-ил	CH ₃	H			
210	2-циано-пирид-4-ил	CH ₃	H			
211	пиримидин-5-ил	CH ₃	H			
212	2-CH ₃ -пиримидин-5-ил	CH ₃	H			
213	3-OCH ₃ -изоксазол-5-ил	CH ₃	H			

Продолжение табл. 1

Соединение №	R ¹	R ²	A	Олефин ⁺	Т.пл. °C	Соотношение изомеров ⁺⁺
214	3-Br-изоксазол-5-ил	CH ₃	H			
215	5-NO ₂ -триазол-2-ил	CH ₃	H			
216	5-CH ₃ -тиазол-2-ил	CH ₃	H			
217	4-CH ₃ -тиазол-2-ил	CH ₃	H			
218	2-Cl,4-CH ₃ -тиазол-5-ил	CH ₃	H			
219	3,5-ди-OCH ₃ -1,2,4-триазин-6-ил	CH ₃	H			
220	3,6-ди-CH ₃ -пиридазин-4-ил	CH ₃	H			
221	2-(C ₆ H ₅ O)-C ₆ H ₄	CH ₃	H			
222	3-(C ₆ H ₅ O)-C ₆ H ₄	CH ₃	H			
223	4-(C ₆ H ₅ O)-C ₆ H ₄	CH ₃	H			
224	1,2,4-триазол-1-ил-CH ₂	CH ₃	H			
225	C ₆ H ₅	OCH ₃	H	7,53	резиноподобная	
226	OCH ₃	C ₆ H ₅	H	7,58	резиноподобная	
227	C ₆ H ₅	CH ₃ S(O)	H	7,60	резиноподобная	
228	C ₆ H ₅	CH ₃ S(O) ₂	H	7,60	резиноподобная	
229	C ₆ H ₅	N(CH ₃) ₂	H			
230	C ₆ H ₅ O	CH ₃	H			
231	C ₆ H ₅	Br	H			
232	C ₆ H ₅	I	H			
233	C ₆ H ₅	(CH ₃) ₂ CHS	H			
234	Пиримидин-2-ил	CH ₃ O	H			
235	Пиразин-2-ил	Cl	H			

Ключ

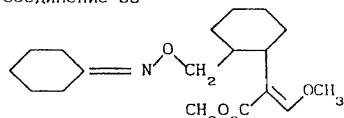
⁺ Химический сдвиг синглета олефинового протона β-метоксипропеноатной группы в основном изомере оксимового эфира (м. ч. относительно тетраметилсилана).

* Химический сдвиг синглета протона альдоксима, где он присутствует.

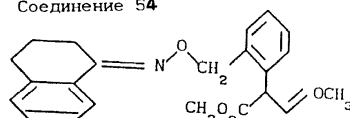
⁺⁺ Изомеры несимметрично замещенной двойной связи оксима.

Ø Группа R¹ и R² образует следующее кольцо:

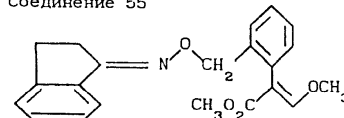
Соединение 53



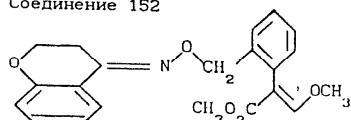
Соединение 54



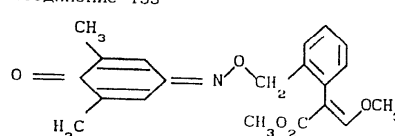
Соединение 55



Соединение 152



Соединение 153



Соединение №	R ₁	R ₂	A	Олефиновый показатель ⁺	Точка плавления
98	2-CH ₃ O-Пиримидин-4-ил	CH ₃	H		115-6
138	3-CH ₃ -Пиридазин-6-ил	CH ₃	H		88-91
189	C ₆ H ₅	CH ₃	H	7,61	Масло
214	3-Br-Изоксазол-5-ил	CH ₃	H	7,60	Масло
236	2-OC ₂ H ₅ -Пиразин-2-ил-	CH ₃	H	7,50	81-82
237	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,64	82-83
238	6-CH ₃ -Пирид-2-ил	CH ₃	H	7,58	Масло

Продолжение табл. 3

Соединение №	R ₁	R ₂	A	Олефиновый показатель ⁺	Точка плавления
239	Пирид-2-ил	SCH ₃	H	7,59	Масло
240	Пирид-2-ил		H	7,60	150-4
241	Пирид-2-ил	SO ₂ CH ₃	H	7,60	124-7
242	3-SCH ₃ -1,2,4-Триазин-5-ил	SOCH ₃	H	7,62	122-3
243	3,5-Ди-CH ₃ -оксазол-4-ил	CH ₃	H	7,58	Масло
244	3-OCH ₃ -1,2,4-Триазин-5-ил	CH ₃	H	7,61	Масло
245	Пирид-2-ил	OCH ₃	H	7,59	Масло
223	4-(C ₆ H ₅ O)-C ₆ H ₄	CH ₃	H		
224	1,2,4-Триазол-1-ил-CH ₂	CH ₃	H		
246	Пирид-2-ил	SC ₂ H ₅	H	7,57	102-6
247	Пирид-2-ил	OC ₆ H ₅	H	7,54	Масло
248	Пирид-2-ил	OCH ₂ -C ₆ H ₅	H	7,57	Масло
249	6-OC ₂ H ₅ -Пиримидин-4-ил	CH ₃	H	7,60	37-8
250	2,6-Ди-CH ₃ -Пиримидин-4-ил	CH ₃	H	7,48	102
251	Пирид-2-ил	NH ₂	H	7,59	Масло
252	Пирид-2-ил	SCH ₃	H	7,56	Масло
253	6-C ₆ H ₅ -Пирамидин-4-ил	CH ₃	H	7,61	102
254	4,6-Ди-CH ₃ -пирамидин-4-ил	CH ₃	H	7,56	108
255	2,4-Ди-F-C ₆ H ₃	CH ₃	H	7,58	Масло
256	2-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,58	Масло
257	2-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,56	Масло
258	2,4-Ди-ОCH ₃ -C ₆ H ₃	CH ₃	H	7,56	98
259	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,59	125
260	5-CH ₃ -Пиримидин-2-ил	CH ₃	H	7,57	122-3
261	Пирид-2-ил	CH ₃	H	7,56	122-7
262	6-CH ₃ -Пиримидин-2-ил	CH ₃	H	7,59	Масло
263	6-OCH ₃ -Пиразин-2-ил	CH ₃	H	7,60	111
264	Пирид-3-ил	CH ₃	H	7,60	Масло
265	Пирид-3-ил	OCH ₃	H	7,61	Масло
266	3-NO ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,66	Масло
267	6-CF ₃ -Пирид-2-ил	CH ₃	H	7,60	Масло
268	3-CF ₃ , 4-F-C ₆ H ₃	CH ₃	H	7,60	Масло
269	2-CF ₃ -C ₅ H ₄	CH ₃	H	7,57	Масло
270	6-CF ₃ -Пиримидин-4-ил	CH ₃	H		87,2-88,4
271	3,3-Ди-F-C ₆ H ₃	CH ₃	H	7,60	Масло
272	2-CH ₃ S-Пиримидин-4-ил	CH ₃	H		102,2-104,4
273	2-CF ₃ -Пиримидин-4-ил	CH ₃	H		105-106
274	4-CF ₃ -Пирид-2-ил	CH ₃	H	7,61	Масло
275	2-Фенилтиазол-4-ил	CH ₃	H	7,59	Масло
276	3-NH ₂ C-(O)-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,59	Масло
277	4-CF ₃ -Пиримидин-2-ил	CH ₃	H	7,58	Масло
278	3,5-Ди-CF ₃ -C ₆ H ₃	CH ₃	H		108-110
279	2-(2-CN-C ₆ H ₄ -O)-Пиримидин-4-ил	CH ₃	H		108-110
280	3-nC ₃ H ₇ O-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,59	Масло
281	2-CH (CH ₃ /2-O-Пиримидин-4-ил	CH ₃	H		88-90
282	6-CH ₃ -Пиразин-2-ил	CH ₃	H		72-4
283	4-C ₂ H ₅ O-Пиримидин-2-ил	CH ₃	H		84-96

284	6-C ₂ H ₅ -п-Пиримидин-4-ил	CH ₃	H	7,61	Масло
285	3-CF ₃ O-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,60	Масло
286	4-СНО ₃ -Пирид-2-ил	CH ₃	H		60-62
287	2-Пропаргиллокси-пиримидин-4-ил	CH ₃	H		121-122,4
288	2-C ₂ H ₅ O-Пиримидин-4-ил	CH ₃	H		94-96
289	2-Аллилокси-пиримидин-4-ил	CH ₃	H		74-76
290	3-CH ₃ O-Пиридазин-6-ил	CH ₃	H		124-126
291	3-C ₂ H ₅ O-Пиридазин-6-ил	CH ₃	H		90-91
292	3-Аллилокси-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,59	Масло
293	1-CH ₃ S-Пиримидин-2-ил	CH ₃	H		79-81

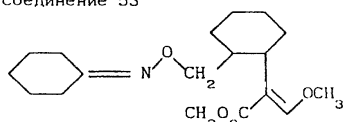
Продолжение табл. 3

Соединение №	R ₁	R ₂	A	Олефиновый показатель ⁺	Точка плавления
294	4-CH ₃ O-Пиримидин-2-ил	CH ₃	H	7,58	Масло
295	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,59	Масло
296	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	CF ₃	H	7,56	Масло
297	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	C ₂ H ₅	H	7,60	Масло
298	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	Имидазолил	H	7,61	Масло
299	3-CF ₃ -C ₆ H ₄		H	7,58	Масло
300	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	N(CH ₃) ₂	H	7,52	Масло
301	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	NHCH ₃	H	7,58	Масло
302	PO(OC ₂ H ₅) ₂	CH ₃	H	7,56	Масло
303	PO(OC ₂ H ₅) ₂	C ₆ H ₅	H	7,53	Масло
304	4-CH ₃ O-6-(CO ₂ CH ₃)-Пиримидин-2-ил	CH ₃	H	7,59	Масло
305	Пиррол-2-ил	CH ₃	H	7,58	Масло Изомер А
306	Пиррол-2-ил	CH ₃	H	7,56	Масло Изомер В
307	5-CF ₃ -Пирид-3-ил	CH ₃	H		96,4-97,6
308	3-(Пиримидинилокси)-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,59	Масло
309	3-Пропаргиллокси-C ₆ H ₄	CH ₃	H	7,60	Масло
310	CH ₃	H	H	7,46	Масло
311	3,5-Ди-CH ₃ -оксазол-4-ил	CH ₃	H	7,58	Масло
312	SCH ₃	Пирид-2-ил	H	7,56	Масло

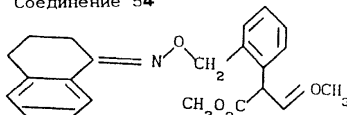
Примечание. + Химическое смещение синглета относительно олефинового протона группы β-метоксипропеноата основного изомера простого оксимового эфира (млн долей от тетраметилсилана).

Ø - группы R₁ и R₂ соединены, образуя указанные кольца:

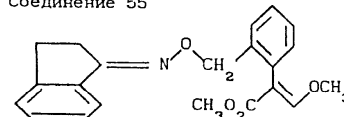
Соединение 53



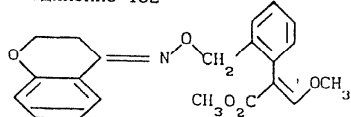
Соединение 54



Соединение 55



Соединение 152



Соединение 153

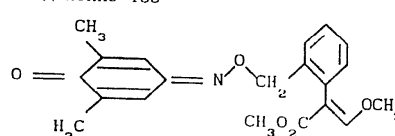


Таблица 5

Соединение	Таблица	Puccinia recondita Пшеница	Erysiphe graminis hordei Ячмень	Venturia inaequalis Яблоня	Pyricularia oryzae Рис	Cercospora arachidicola Земляной орех	Plasmopara viticola Виноград	Phytophthora infestans Томаты
1	1	-	3	4	4	4	4	4
2	1	4	4	4	4	4	4	3
5	1	4	4	4	-	4	4	3
6	1	-	4	4	3	4	4	4
11	1	4	4	4	-	4	4	3
17	1	4	4	4	-	4	4	3
20	1	4	4	4	-	4	4	3

22	1	3	4	4	-	4	4	4
23	1	4	4	4	-	4	4	4
29	1	4	1	4	-	4	4	1
32	1	3	4	4	4	4	4	3
37	1	4	4	4	-	4	4	4
38	1	4	4	4	-	4	4	0
39	1	3	0	0	-	2	0	0

Продолжение табл. 5

Соединение	Таблица	<i>Puccinia recondita</i> Пшеница	<i>Erysiphe graminis hordei</i> Ячмень	<i>Venturia inaequalis</i> Яблоня	<i>Pyricularia oryzae</i> Рис	<i>Cercospora arachidicola</i> Земляной орех	<i>Plasmopara viticola</i> Виноград	<i>Phytophthora infestans</i> Томаты
40	1	4	4	4	-	4	4	4
41	1	3	4	2	0	-	4	4
42	1	1	0	4	-	3	4	3
45	1	3	4	4	0	-	2	2
47	1	4	4	4	4	4	4	4
49	1	0	0	4	-	2	4	0
55	1	4a	4a	4a	3a	4a	4a	4a
62	1	4	4	4	4	-	4	4
63	1	4	4	4	4	4	4	4
64	1	4	4	4	3	4	4	0
65	1	4	4	4	3	4	4	0
66	1	-	4	4	0	2	4	4
67	1	-	3	0	0	3	4	2
89	1	4	4	4	4	4	4	4
90	1	4a	4a	4a	0a	4a	4a	0a
92	1	4	4	4	-	-	4	4
93	1	3	2	3	-	-	4	3
101	1	4	4	4	3	4	4	3
110	1	4	4	4	-	-	4	2
112	1	4	4	3	3	-	0	0
113	1	4	4	4	4	-	4	4
116	1	4	4	4	-	-	4	4
121	1	4	4	0	3	-	0	0
125	1	4	4	4	3	4	4	3
127	1	4	4	4	-	-	4	4
130	1	4	4	4	-	-	4	2
139	1	4	3	4	0	4	4	0
140	1	3	3	4	3	-	4	3
143	1	4	4	4	4	4	4	0
144	1	3	4	4	3	-	4	4
152	1	4	4	4	4	2	4	3
153	1	2	0	2	0	2	0	0
154	1	4	4	4	4	-	4	3
156	1	2	4	4	0	3	4	3
157	1	3	4	4	2	3	4	4
158	1	4	3	4	2	3	4	4
159	1	4	4	4	2	3	0	0
162	1	4	4	4	4	4	4	3
165	1	0	0	0	-	1	0	0
173	1	4	4	4	0	4	4	0
174	1	4	-	4	3	4	4	3
175	1	4	4	4	4	4	4	3
176	1	4	4	4	4	4	4	3
177	1	4	4	4	4	-	4	4
183	1	3a	3a	3a	0a	4a	4a	3a
184	1	4	4	4	2	4	4	4
185	1	4	4	4	-	-	4	2
186	1	4a	4a	4a	-	-	4a	0a
188	1	4	4	4	4	-	4	4
194	1	4	0	4	4	-	4	4

Примечание. -/- Отсутствие результата, /a/ 10 млн. доз. опрыскивание только листья.

Таблица 6

Соединение	Таблица	Pr	Egh	Egt	Sn	Po	Tc	VI	Ca	Pv	PII
75	1	4	4						4	4	4
98	1	4a		0a	4a	3a		4a		4a	4a
102	1	4	4						4	4	4
108	1		4			4		4		4	4
111	1		4			4		4		4	4
114	1		4			4		4		4	4
115	1	4	4		4	4	4	4		4	4
118	1	4	4						4	4	4
123	1	4	4						4	4	0
131	1	4	4						4	4	4
138	1	3		4	4	4	4	4		4	2
145	1	4	4			4				4	0
160	1	3	3			0		0	4	0	0
163	1	4	4							4	4
189	1	4a		3a	4a	4a		4a	4	4a	
190	1	4	4						4a	4	3
191	1	4a	4a							4a	4a
196	1	4	4					4		4	4
198	1	4	4						4	4	4
214	1	4		4	4	3		4		4	3
225	1	3a	2a						3a	1a	0a
226	1	4a	4a						4a	4a	0a
227	1	3	4						4	4	0
228	1	0a	0a						0a	3a	0a
236	1	4	4			4		4		4	2
237	1	4	4			4		4		4	4
238	1	4	4			4		4		4	4
239	1	4	4			4		4		4	4
242	1	4	4			4	4	3		4	2
243	1	4	4			4		4		4	4
244	1	0a	3a			0a		4a		4a	0a
246	1	2	4			1		0		3	0
247	1	2	0			0		0		3	0
248	1	2	3			2		2		4	0
249	1	4	4			4		4		4	3
250	1	4	4		4	4	4	4		4	4
251	1	4a	3a		2a	2a	1a	3a		0a	0a
252	1	1a	0a		0a	0a	1a	2a		4a	0a
253	1	4	4		4	3	4	4		3	0
254	1	4	4		3	4	3	4		4	4
255	1	4	4		3	3	4	4		4	4
256	1	4	4		3	4	4	4		4	4
257	1	4	4		2	4	4	4		4	4
258	1	4	4		3	4	3	4		4	2
259	1	4	4		4	4	4	4		4	3
260	1	4	4		4	4	4	4		4	4
262	1	4	4		4	4				4	
263	1	4	4		4	4	3	4		4	0
264	1	3a		0a	0a	0a	0a	2a		2a	3a
265	1	4a		0a	0a	0a		4a		0a	
266	1	4		4	3	4		4		4	
267	1	4		4	3	3		4		4	1
268	1	4		4	2	3		4		4	4
270	1	4		4	4	4		4		4	4
271	1	4		4	4	3		4		4	3
272	1	4		4	4	4		4		4	4
273	1	4		4	3	3		4		4	3

274	1	4		4	4	4		4		4	0
275	1	4		4	4	4		4		4	4
276	1	4		4	4			3		4	3

Продолжение табл. 6

Соединение	Таблица	Pr	Egh	Egt	Sn	Po	Tc	VI	Ca	Pv	PII
277	1	4		4	4	4	4	4		4	3
278	1	4		4	4	4	4	4		4	3
279	1	4		4	0	3	0	4		4	0
280	1	4		4	4	4	4	4		4	4
281	1	4a		0a	0a	4a		4a		4a	0a
282	1	4		4	4	4		4		4	4
283	1	4		4	0	4		4		4	4
284	1	4a		4a	0a	4a	3a	4a		4a	2a
285	1	4		4				4		4	4
286	1	4		4	4	4	4	4		4	3
287	1	4		4	4	3	4	4		4	4
288	1	4		4	4	3	2	4		4	4
289	1	4a		3a	3a	4a	0a	4a		3a	0a
290	1			4	4	4	4	4		4	4
291	1	4		4		4	4	4		4	4
292	1	4		4		4	4	4		4	4
293	1	4		4	4	4	4	4		4	2
294	1	4		4	4	4	4	4		4	3
295	1	4a		4a	0a	4a		4a		4a	
296	1	4		0	4	2		4		1	0
297	1	4		0	4	4		4		4	3
298	1	4		4	4	4				4	3
299	1	4		4	0	4	2	4		4	0
300	1	3a		0a	0a	1a	2a	4a		0a	2a
301	1			4	4	4	4	4		4	4
306	1	2		4	1	4	0	3		4	2
311	1	4	4	4		4		4		4	4
312	1	1a	0a		0a	0a	1a	2a		4a	0a

Примечание. а=10 ч/млн - опрыскивание лишь листья.

Причина заболеваний: Pr - Puccinia recondita. Egh - Erysiphe graminis hordei. Egt - Erysiphe graminis tritici, Sn - Septoria nodorum, Po - Pyricularia oryzae, Tc - Thanetophorus cucumeris, Vi-Venturia inaequalis, Ca - Cercospora arachidicola, Pv - Plasmopara viticola, PiL - Phytophthora infestans lycopersici.

Таблица 7

Соединение	Puccinia recondita Пшеница	Erysiphe graminis hordei Ячмень	Venturia inaequalis Яблоня	Pyricularia oryzae Рис	Cercospora arachidicola Арахис	Plasmopara viticola Виноград	Phytophthora infestans Помидор
Манкозеп	3	0	4	0	0	4	1
Карбоксин	3	0	4	0	0	0	0
Пироксифур	0	0	0	0	0	0	-

Таблица 8

Соединение	Расход млн ¹	Tu AC	Tu Eo	Tu NG	MP MC	NC NC	NC NG	MD AK	MD AC	BG NK	BG NC	HV LR	HV LG	SP LR	SP LG	DB LR	MI JC
20	1000 25	9	0	0	0	0	0	9	9	0	0	0	0	5	5	0	0
22	1000 25	0	0	0	0	5	9	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
29	1000 25	9	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
32	500 25	0	0	0	0	0	0	0	0	5	5	0	0	0	0	0	0
37	1000 25	0	0	0	0	0	9	0	0	0	0	0	0			9	0
38	1000 25	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0			0	0
40	1000 25	0	0	0	9	9		9	9	0	0	0	9	0	0	5	0
42	1000 25	9	0	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
47	500				0	5	9	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
49	1000 25	0	0	0	0	9		0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
62	500				0	0	0	0	5	0	0	0	0	0	0	0	0
63	500 12,5	0	0	0	5	0	9	9	9	0	0	0	0	0	0	5	0
64	500 12,5	5	0	0	5	0	0	9	9	0	0	0	0	0	0	5	0
89	500 12,5	0	0	0	0	5	9	5	9	0	0	0	0	0	0	9	0
93	500				0	0	0	0	0	0	0	9	0			0	
101	500 12,5				0	0	0	0	5	0	0	0	5			0	0
112	500 12,5				9	5	5	0	9	0	0	0	0			9	0
125	500 12,5				0	0	0	5	9	0	0	0	0			0	0
140	500					9		0	0	0	0	0	0	0	0	0	
144	500				0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	9	
152	500 12,5	0	0	0	0	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
153	500 12,5				0	9		0	0	0	0	9				0	0
157	500				5	0	9	0	0	0	0	0	0	0	0	9	
158	500				0	0	5	0	0	0	0	0	9	0	0	0	
159	500				9	9		0	0	0	0	0	5	5	5	9	
160	500 12,5				5	0	0	9	0	0	0	0	0			0	0
174	500 12,5				0	0	0	9	9	0	5	0	9			9	0
175	500				0	0	0	0	5	0	0	0	0			5	0
176	500				0	0	0	9	9	0	0	0	0			0	0
177	500				0	0	0	5	0	0	0	0	0			5	0

Таблица 9

Буквенные коды Таблица	Испытываемые виды	Среда носитель / корм	Тип испытания	Продол- жительность, дни
АС	Клещик паутинный взросл	Листья фасоли обыкновенной	Контакт	3
ЕО	Спешик паутинный яички	Листья фасоли обыкновенной	Контакт	3
	Клещик паутинный нимфа	Листья фасоли обыкновенной	Контакт рост	6
МС	Тля	Листья капусты китайской	Контакт	3
	Зеленая цикадка нимфа	Растение риса	Контакт	2
МС	Зеленая цикадка нимфа	Растение риса	Контакт	6
АК	Комнатная муха взрослая	Пластический лоток	Контакт нокдаун	15 мин
АС	Комнатная муха взрослая	Пластический лоток	Контакт	3
ВС	Нимфа таракана	Пластический лоток	Контакт нокдаун	15 мин
ВС	Нимфа таракана	Пластический лоток	Контакт	2
	Совка личинка	Листья хлопка	Остаточное	2
	Совка личинка	Листья хлопка	Остаточное рост	5
ВС	Походный червь личинка	Листья хлопка	Остаточное	2
	Походный червь личинка	Листья хлопка	Остаточное рост	5
	Листоед личинка	Фильтровальная бумага / зерно кукурузы	Остаточное	2
	Корневая нематода личинка	В пробирке	Контактное	1

Примечание. Контактное испытание означает, что обрабатывались и вредители и среда, а остаточное означает, что среда обрабатывалась перед заражением вредителями.