

(19) **KG** (11) **194** (13) **C2**

ГОСУДАРСТВЕННОЕ АГЕНТСТВО
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ
ПРИ ПРАВИТЕЛЬСТВЕ КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ (КЫРГЫЗПАТЕНТ)

(51)⁶ **C07D 233/60, 249/08, 303/06;**
C07C 13/11, 49/395, 69/757

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

к патенту Кыргызской Республики

(21) 940238.1

(22) 26.07.1994

(31) 161126/87; 271277/87

(32) 30.06.1987; 27.10.1987

(33) JP

(46) 01.04.1997, Бюл. №4, 1997

(71)(73) Куреха Кагаку Когио Кабусики Кайся (JP)

(72) Сатору Кумазава, Сусуму Симизу, Хироюки Енари, Ацуси Ито, Сусуму Икеда, Нобуо Сато, Тосихиде Сайсодзи (JP)

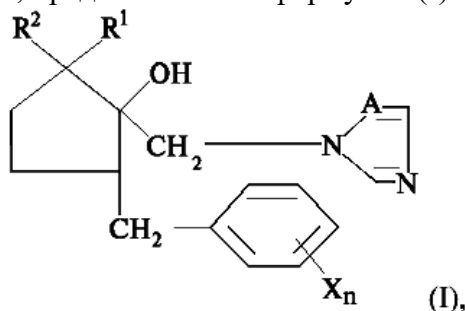
(56) Патент Франции №2587028 кл. C07D 333/60, опубл. 1987

(54) Производные азола и промежуточные соединения для их получения

(57) Использование: для борьбы с болезнями растений и их роста. Сущность изобретения: продукт - производные азола I. Промежуточные продукты для получения азола I - производные оксирана II, производные метилен-циклопентана III, производные циклопентано-та IV; производные сложного эфира цикло-пентанкарбоновой кислоты IV. Получают I-IV-III-II-I. 5 с. и 2 з.п. ф-лы, 35 табл.

Изобретение касается производного азола, обладающего активностью в борьбе с болезнями растений и регулирующей рост активностью, способов получения азольного производного и промежуточных соединений для получения соединения, содержащего азольное производное. В частности изобретение касается:

1) производного азола, представленного формулой (I)

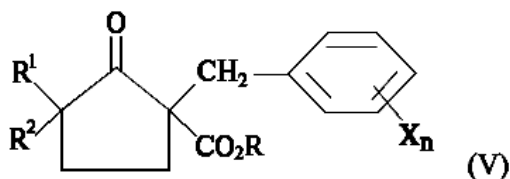


в которой R¹ и R² представляют собой соответственно C₁-C₅ - алкильную группу или атом

водорода; X - атом галогена: или алкильную группу с 1-5 атомами углерода или фенильную группу; и n - целое число 0 - 2, A – атом азота или СН при условии, что R¹ не является H, если R² является атомом водорода;

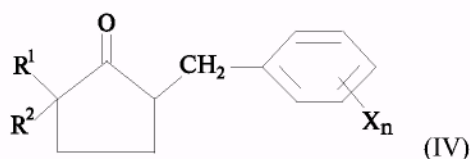
2) способа получения производного азола, представленного формулой (I), включающего следующие операции:

а) (I) взаимодействие сложного алкильного эфира 2 - оксиклопентанкарбоновой кислоты с подходящим замещенным галоидным бензилом и взаимодействие полученного таким образом сложного алкильного эфира 1-(замещенный бензил)-2-оксиклопентанкарбоновой кислоты с C₁-C₅ алкилгалогенидом; (II) взаимодействие сложного алкильного эфира 3-(C₁-C₅-алкил)-2-оксиклопентанкарбоновой кислоты с замещенным галоидным бензином или (III) взаимодействие 1-(замещенный бензил)-3-(C₁-C₅-алкил)-2-оксиклопентанкарбоновой кислоты с галоидным C₁-C₅ алкилом, с получением при этом производного сложного эфира циклопентанкарбоновой кислоты, представленной формулой



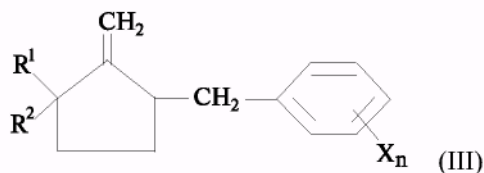
в которой R¹ и R² соответственно представляет собой C₁-C₅ – алкильную группу или атом водорода: R-C₁-C₅ алкильную группу; X-атом галогена: C₁-C₅ – алкильную группу или фенильную группу и n означает целое число 0-2, при условии, что R¹ не является атомом водорода, если R² является атомом водорода;

б) гидролитическое декарбоксилирование полученного таким образом производного сложного эфира циклопентанкарбоновой кислоты с получением при этом производного циклопентанона, представленного формулой,

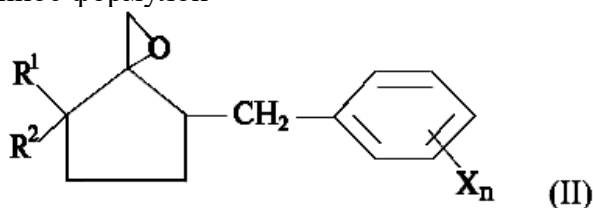


в которой R¹, R², X и n соответственно имеют те же значения, определенные для них выше;

с) полученное таким образом производное циклопентанона подвергают оксидановой реакции, используя илиды сульфония или оксосульфония, или подвергают метиленциклопентановое производное, полученное таким образом из производного циклопентанона реакций Виттига и представленное формулой

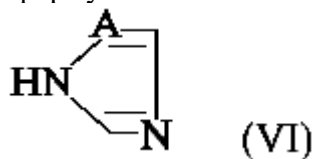


в которой R¹, R², X и n соответственно имеют значения, определенные ранее, эпексидированию, обращая при этом производное циклопентанона в этиленоксидное производное, представленное формулой

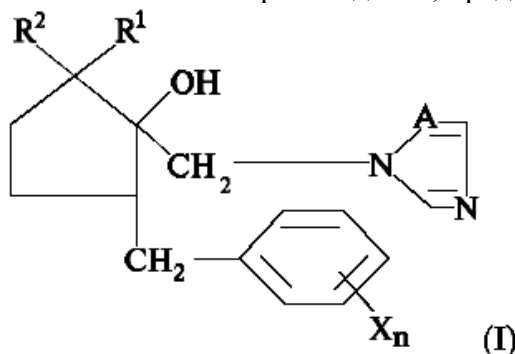


в которой R¹, R², X и n соответственно представляют собой те же значения, которые были определены для них ранее, и затем

d) взаимодействие полученного этиленоксидного производного с 1, 2, 4- триазолом или амидозолом, представленным формулой



где М представляет собой атом водорода или атом щелочного металла и А - атом азота или -CH= с получением при этом азольного производного, представленного формулой



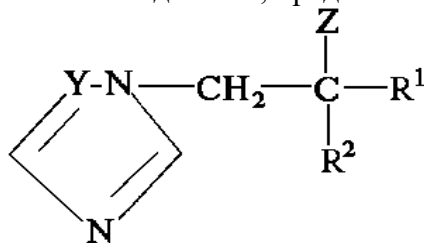
в которой R^1 и R^2 соответственно представляют собой алкильную группу с 1 - 5 углеродными атомами или атом водорода; X является атомом галогена, алкильную группу с 1 - 5 атомами углерода или фенильной группой; n - целое число 0 - 2 и А- атом водорода или СН при условии, если R^1 не является атомом водорода, а R^2 является атомом водорода, и композиции для использования в полеводстве и садоводстве, обладающей фунгицидной активностью и регулирующей рост растений активностью, которая включает эффективное количество производного азола, представленного формулой (I).

Ущерб, причиняемый культурным растениям болезнями растений, огромен и возникает также проблема загрязнения окружающей среды, обусловленного химикалиями, используемыми в борьбе с болезнями растений.

Следовательно, предложение химиката для полеводства и садоводства, который был бы эффективным в борьбе с болезнями растений, имел низкую токсичность по отношению к человеку, зверям, птицам и рыбам и низкую фитотоксичность к полезным растениям, т.е. сельскохозяйственного химиката, обладающего отличным действием против болезней растений в широком диапазоне, высоко безопасного в обращении и оказывающего незначительное влияние на окружающую среду, является насущной необходимостью.

Чтобы удовлетворить эту потребность, были предложены следующие фунгициды для использования в полеводстве и садоводстве.

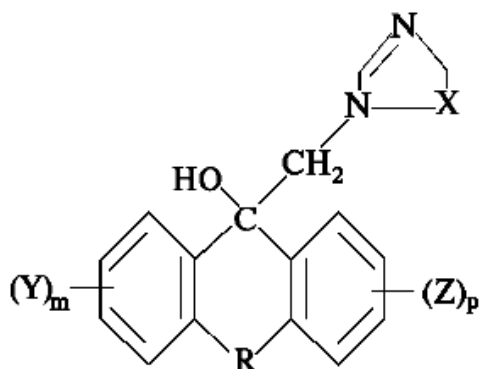
1) Соединения триазолов или имидазолов, представленные следующей формулой:



в которой R^1 представляет собой -CH=CH-X, -C=C-X или -CH₂-CH₂-X (где X означает атом водорода, алкильную группу, оксиалкильную группу, алкоксиалкильную группу, циклоалкильную группу, замещенную ариальную группу, которая может быть замещена, аралкильную группу, которая может быть замещена, арилоксиалкильную группу, которая может быть заменена, или гетероциклическую группу, которая может быть замещена); R^2 представляет собой алкильную группу, циклоалкильную группу или арильную группу, которая может быть замещена; Z представляет собой атом хлора, или цианогруппу или -OR³ (где R^3 является атомом водорода, ацетильной группой, алкильной группой,

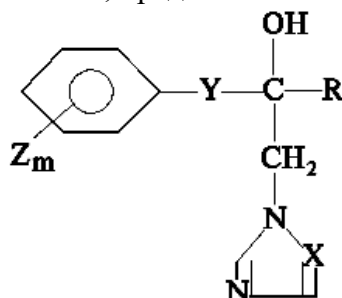
алкенильной группой или аралкильной группой) и Y представляет собой атом азота или СН, и их кислые аддитивные соли и их металлические комплексы.

2) Соединение триазолов или имидазолов, представленные следующей формулой:



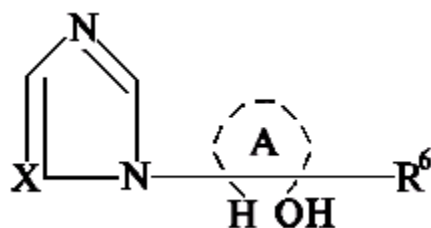
в которой R представляет собой группу с мостиковой связью: $-\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, $-\text{NH}-$ или $-\text{C}(=\text{O})-$; X представляет собой атом азота или СН; Y и Z могут быть одинаковыми или отличными друг от друга и соответственно представляют собой атом галогена, алкильную группу, алкоксигруппу, галоидоалкокси-группу, галоидалкильную группу, нитрогруппу, фенильную группу или феноксигруппу, а m и p соответственно означают 0, 1, 2 или 3, и их кислоты, металлический комплекс и их функциональные производные.

3) Производные 1-оксиэтилазола, представленные следующей формулой:



в которой R представляет собой алкильную группу, циклоалкильную группу, которая может быть замещена, или фенильную группу, которая может быть замещена; X - атом азота или СН; Y представляет собой $-\text{OCH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ или $-\text{CH}=\text{CH}-$; Z - атом галогена, циклоалкильную группу, алкокси-группу, алкилиогруппу, галогеноалкильную группу, галоидоалкоксигруппу, галоидал-килтиогруппу, фенильную группу, которая может быть замещена, феноксигруппу, которая может быть замещена, или фенилал-кильную группу, которая может быть замещена, или фенилалкоксигруппу, которая может быть защищена, а m означает 0, 1, 2 или 3; их кислые аддитивные соли и металлические комплексы.

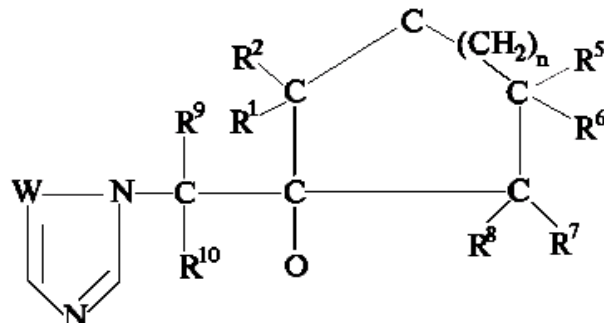
4) Соединения циклоалифатических спиртов, представленные следующей формулой:



в которой R^6 представляет собой незамещенную фенильную группу или замещенную фенильную группу 1-5 группами, выбранными среди групп, включающих атом(ы) галогена, аминогруппу(ы), нитрогруппу(ы), циано-группу(ы), фенильную группу(ы), галоидо-фенильную группу (ы), $\text{C}_1\text{--C}_{10}$ - алкильную группу(ы), галоидо- $\text{C}_1\text{--C}_{10}$ - алкильную группу(ы), $\text{C}_1\text{--C}_{10}$ -алкоксигруппу(ы), галоидо- $\text{C}_1\text{--C}_{10}$ -алкоксигруппу(ы), $\text{C}_1\text{--C}_{10}$ -алкилтиогруппу(ы), $\text{C}_1\text{--C}_{10}$ -алкилендитиоксигруппу(ы), ди- $\text{C}_1\text{--C}_{10}$ алкиламиногруппу(ы), и ди- $\text{C}_1\text{--C}_{10}$ - алкиламиногруппы; X представляет собой атом азота или метиловую группу; кольцо A является цикlopentanовым кольцом, циклогексановым, циклогептановым,

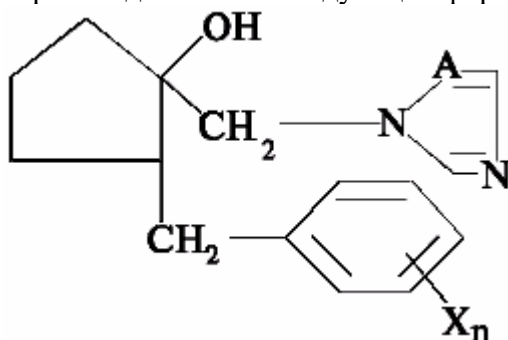
индановым, тетра-гидронафталиновым или бензоциклопентановым кольцом, каждое из перечисленных колец незамещено или замещено в бензольном кольце 1 - 4 заместителями из числа упомянутых выше (ссылка на выложенную заявку (Кокай) на патент Японии № 58-189171 (1983), соответствующую патенту США №4503062 и Европейскому патенту № 94146).

5) Триазольные или имидазольные соединения, представленные следующей формулой:



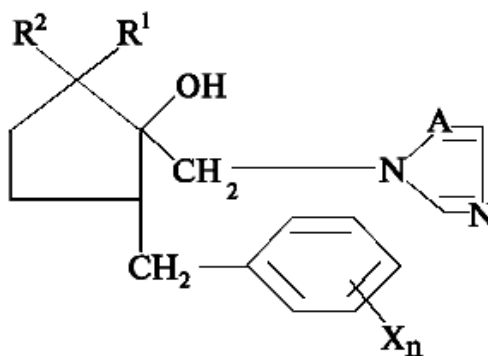
в которой W является СН или атом азота; О-замещенной или незамещенной арильной группой, в частности, замещенной или незамещенной аралкильной группой, или замещенной или незамещенной алкильной группой; R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 и R^8 могут быть одинаковыми или отличными друг от друга и соответственно представляют собой атом водорода, оксигруппу, алкильную группу, циклоалкильную группу, замещенную или незамещенную аралкильную группу, замещенную или незамещенную фенильную группу или любая из пар радикалов R^1 и R^2 , R^3 и R^4 , R^5 и R^6 или R^7 и R^8 представляет собой карбонильную группу (C=O) вместе с соседним углеродным атомом кольца; R^9 и R^{10} могут быть одинаковыми или отличными друг от друга и представляют собой соответственно атом водорода, алкильную группу, циклоалкильную группу, замещенную или незамещенную аралкильную группу или замещенную или незамещенную фенильную группу и означает 0 или 1; их стереоизомеры, их кислые аддитивные соли и их металлические комплексы (ссылка на выложенную заявку (Кокай) на патент Японии №60-215674 (1985), соответствующую Европейскому патенту №153797).

Французский патент №2587028, опубликованный 13 марта 1987 г. (соответствует патенту УВ №2180236, опубликованный 15 марта 1987 г.), раскрывает ближайший аналог предложенных соединений производное азолоа следующей формулы:



в которой X представляет собой соответственно атом галогена, алкильную группу, фенильную группу, цианогруппу или нитрогруппу; n - целое число 0 - 5 и A представляет собой атом азота или СН при условии, что X может быть одинаковым или разным, если n равно 1 - 5, полезное для подавления болезней растений.

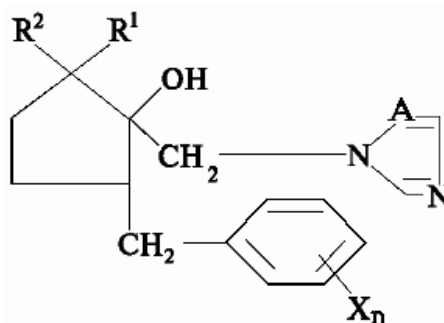
Далее изобретение предусматривает синтез многих производных азолоа и их проверку на полезность в качестве фунгицида для растениеводства и садоводства, который был бы малотоксичным для человека и животных, был бы безопасным в обращении и проявлял высокую эффективность в борьбе с широким спектром болезней растений, и в результате этих исследований было установлено, что производное азолоа, представленное формулой (I).



в которой R^1 и R^2 соответственно представляет собой C_1 - C_5 - алкильную группу или атом водорода; X - атом галогена, C_1 - C_5 - алкильную группу или фенильную группу; n -означает целое число 0 - 2 и A - атом азота или CH при условии, что R^1 не является атомом водорода, если R является атомом водорода, не только обладает упомянутыми выше свойствами, но еще и может быть эффективно применено в качестве средства, регулирующего рост растений. На основе установления этих феноменов было создано изобретение.

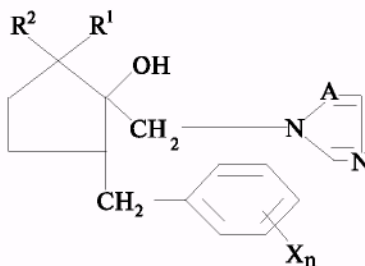
Целью изобретения является производное азола полезное в качестве активного ингредиента в композиции, применяемой в полеводстве и садоводстве, обладающей активностью в борьбе с болезнями растений и проявляющей активность в регулировании роста растений, способ получения производного азола и композиция, для применения в полеводстве и садоводстве, содержащая в качестве активного ингредиента производное азола, которое обладает высоким действием в борьбе с различными болезнями растений и в то же время является эффективным регулятором роста растений, малотоксичным и безопасным в обращении.

В первом аспекте изобретения предусмотрено производное азола, представленное формулой (I)



в которой R^1 и R^2 соответственно представляют собой C_1 - C_5 - алкильную группу или атом водорода; X - атом галогена, C_1 - C_5 -алкильную группу или фенильную группу; n означает целое число 0 - 2 и A представляет собой атом азота или CH при условии, что R^1 не является атомом водорода, если R^2 является атомом водорода.

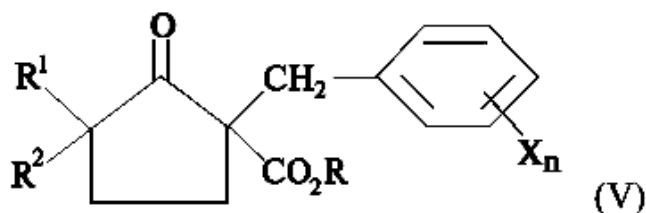
Вторым аспектом изобретения предусмотрен способ получения производного азола, представленного формулой (I)



в котором R^1 и R^2 соответственно представляют собой C_1 - C_5 - алкильную группу или атом водорода; X представляет собой атом галогена или алкильную группу с 1 - 5 углеродными атомами или фенильную группу; n - целое число 0 - 2 и A представляет собой атом азота

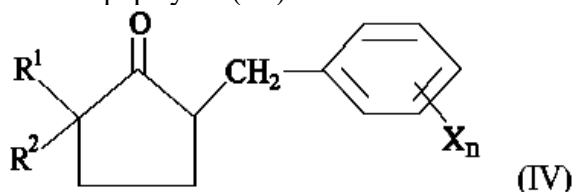
или СН при условии, что R^1 не является атомом водорода, если R^2 является атомом водорода, который (способ) включает следующие операции:

а) (I) взаимодействие сложного алкильного эфира 2-оксоцикло-пентанкарбоновой кислоты с замещенным галоидным бензилом и взаимодействие полученного таким образом сложного алкильного эфира 1-(замещенный бензил)-2-оксоцикло-пентанкарбоновой кислоты с C_1 - C_5 -галоидоалкилом; (II) взаимодействие сложного алкильного эфира 3-(C_1 - C_5 - алкил)-2-оксоциклопентанкарбоновой кислоты с замещенным галоидным бензилом или (III) взаимодействие 1-(замещенный бензил)-3-(C_1 - C_5 -алкил)-2-оксоциклопентанкарбоновой кислоты с C_1 - C_5 -алкилгалогенидом, получая при этом производное сложного эфира циклопен-танкарбоновой кислоты, представленной формулой (V)



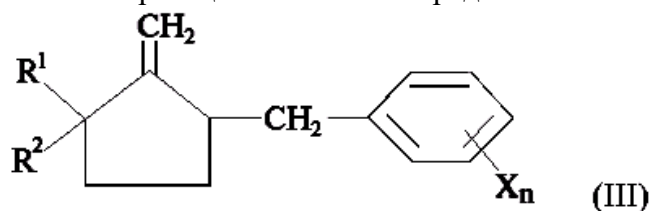
в которой R^1 и R^2 соответственно представляют собой алкильную группу с 1 - 5 углеродными атомами или атом водорода; R-алкильной группой с 1 - 5 углеродными атомами; X представляет собой атом галогена, алкильную группу с 1 - 5 углеродными атомами или фенильную группу и n-целое число 0-2 при условии, что R^1 не является атомом водорода, если R^2 является атомом водорода;

в) гидролитическое декарбоксилирование полученного таким образом производного сложного эфира цикло-пентанкарбоновой кислоты с получением при этом производного циклопентанона формулы (IV)

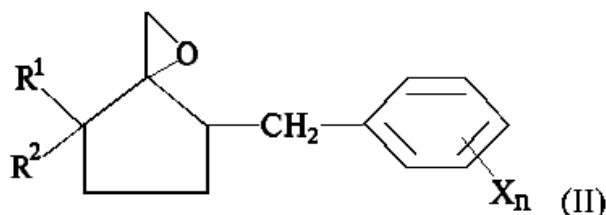


в которой R^1 , R^2 , X и n соответственно имеют значения, определенные для них ранее;

с) проведение оксирановой реакции полученного таким образом производного циклопентанона с использованием илидов сульфония или оксосульфония, или эпексидирования метиленициклопентанового производного, полученного из упомянутого выше производного циклопентанона реакцией Виттига и представленного формулой (III):



в которой R^1 , R^2 , X и n соответственно имеют значения, определенные выше, превращая при этом производное циклопентанона в оксирановое производное, представленной формулой (II)



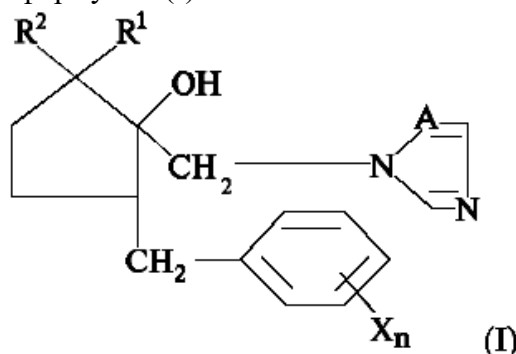
где R^1 , R^2 , X и n имеют значения, определенные для них ранее, и

d) взаимодействие полученного таким образом оксиранового производного с 1, 2, 4-триазолом или имидазолом, представленным формулой (VI)



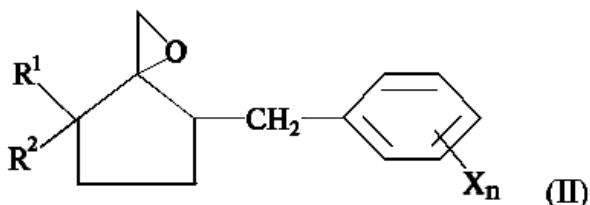
в которой М представляет собой атом водорода или атом щелочного металла и А представляет собой атом азота или СН.

Третьим аспектом изобретения предусмотрена композиция для использования в полеводстве и садоводстве, обладающая фунгицидной активностью и регулирующей рост растений активностью, которая содержит в качестве активного ингредиента азольное производное, представленное формулой (I):



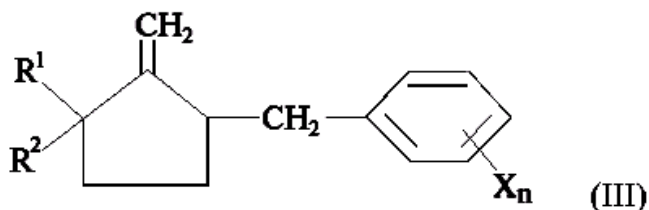
в которой R^1 и R^2 соответственно представляют собой алкильную группу с 1 - 5 углеродными атомами или атом водорода; X-атом галогена, алкильную группу с 1 - 5 атомами углерода или фенильную группу; n-целое число 0 - 2 и А представляет собой атом азота или СН при условии, что R^1 не является атомом водорода, если R^2 является атомом водорода.

Четвертым аспектом изобретения предусматривается этиленоксидное производное для получения производного азола, представленного формулой (I), которое представлено формулой (II).



в которой R^1 и R^2 соответственно представляют алкильную группу с 1 - 5 углеродными атомами или атом водорода; X - атом галогена, алкильную группу с 1 - 5 углеродными атомами или фенильную группу и n означает целое число 0-2 при условии, что R^1 не является атомом водорода, если R^2 является атомом водорода.

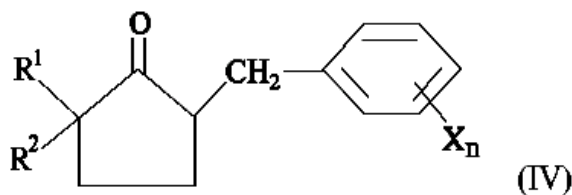
Пятый аспект изобретения предусматривает метиленикклопентановое производное для получения производного азола, представленного формулой (I), которое представлено формулой (III)



в которой R^1 и R^2 соответственно представляют собой алкильную группу с 1 - 5 углеродными атомами или атом водорода; X-атом галогена, алкильную группу с 1 - 5 углеродными атомами или фенильную группу и n означает целое число 0-2 при условии, что R^1 не является атомом водорода, если R является атомом водорода.

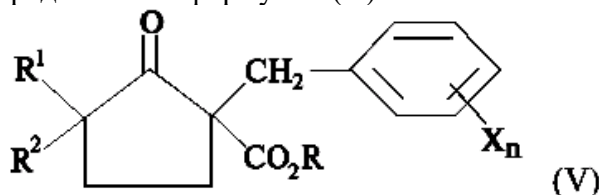
В шестом аспекте изобретение предусматривает циклопентановое производное для

получения производного азола, представленного формулой I; представленное формулой (IV)



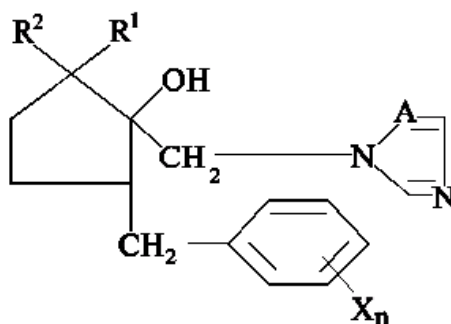
где R¹ и R² соответственно представляют C₁-C₅ алкильную группу или атом водорода; X- атом галогена, C₁-C₅ алкильную группу или фенильную группу и n - целое число 0-2 при условии, что R¹ не является атомом водорода, когда R² - водород.

Седьмой аспект изобретения предусматривает производное сложного эфира циклопентанкарбоновой кислоты для получения производного азола, представленного формулой (I), которое представлено формулой (V)



в которой R¹ и R² соответственно представляют собой алкильную группу с 1 - 5 атомами углерода или атом водорода; R-алкильную группу с 1 - 5 углеродными атомами; X-атом галогена, алкильную группу с 1 - 5 углеродными атомами или фенильную группу и n - целое число 0 - 2 при условии, что R¹ не является атомом водорода, если R² является атомом водорода.

Сущность изобретения - новое азольное производное, представленное формулой (I):



в которой R¹ и R² соответственно представляют собой алкильную группу с 1 - 5 углеродными атомами или атом водорода; X-атом галогена, алкильную группу с 1 - 5 углеродными атомами или фенильную группу; n- целое число 0 - 2 и A - атом азота или СН при условии, что R¹ не является атомом водорода, если R² - атом водорода; способе получения азольного производного, представленного формулой (I), каждое из соединений, используемых в качестве промежуточных, а именно оксирановом производном, представленном формулой (II), метилениклопентановом, представленном формулой (III), циклопентановом, представленном формулой (IV), и производном сложного эфира циклопентанкарбоновой кислоты, представленном формулой (V), и в композиции для использования в полеводстве и садоводстве, содержащей азольное производное формулы (I) в качестве активного ингредиента и обладающей фунгицидной активностью регулятора роста растений.

Физические и химические свойства производного азола, представленного формулой (I) и каждого из промежуточных соединений для получения азольного производного показаны в табл. 1 -5.

Кроме того, каждое из этих промежуточных соединений является новым соединением.

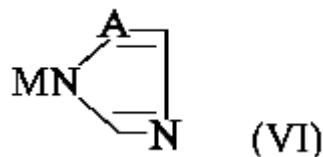
В азольном производном, представленном формулой (I), с точки зрения активности

в борьбе с болезнями растений и активности в регулировании роста растений производное азота, в котором R^1 является атомом водорода или алкильной группой с 1 - 4 углеродными атомами; R^2 является атомом водорода или алкилом с 1 - 3 углеродными атомами (оба R^1 и R^2 не могут представлять собой атомы водорода одновременно); X является атомом галогена, замещающим 4-е положение бензольного кольца; n равно единице и A представляет собой атом азота или СН, предпочтительно и более того азольное производное, в котором R^1 и R^2 соответственно представляют собой атом водорода или алкильную группу с 1 - 3 углеродными атомами (оба R^1 и R^2 не являются атомами водорода одновременно); X представляет собой атом галогена, замещающий 4-е положение бензольного кольца; означает единицу и A представляет собой атом азота, наиболее предпочтительны.

Из соединений, приведенных в табл. 1 предпочтительными соединениями являются соединения 1 - 3, 5, 9 - 11, 16, 18, 29 - 32, 37, 38, 42 - 45, 50, 59, 62, 63, 65 и 69.

Производное азота согласно изобретению получают следующим способом.

Целевое производное азота, представленное формулой (I), может быть получено взаимодействием этиленоксидного производного, представленного формулой (II), с 1, 2, 4- триазолом или имидазолом, представленным формулой (VI), в присутствии разбавителя:

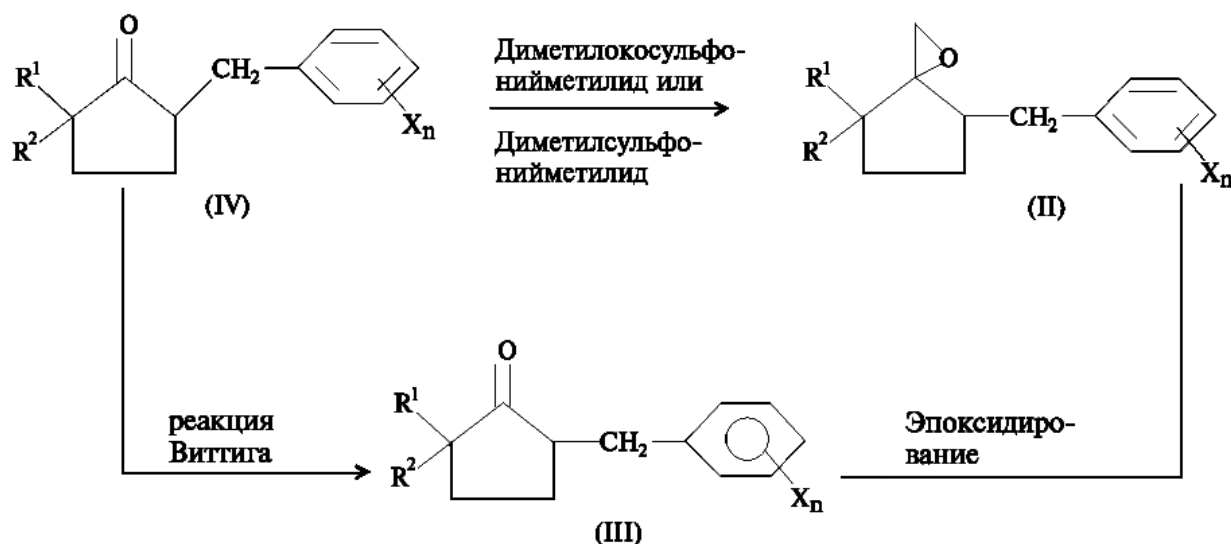


в которой M представляет собой атом водорода или атом щелочного металла и A представляет собой атом азота или СН.

Этиленоксидное производное, представленное формулой (II), которое используется в качестве исходного вещества, может быть получено следующим способом, а именно взаимодействием циклопентанона, представленного формулой (IV), с илидом сульфония или оксисульфония, например метилимидом диметил оксосульфония или метилидом диметилсульфония в присутствии разбавителя по методу, описанному в Org. Synt. 49 78 (1968) и в I. Amer. chem. Soc., (1965) 1353; с получением этиленоксидного соединения, представленного формулой (II) (этот метод назван как А - метод). И еще один, отличный от первого метод (названный как В - метод), согласно которому метиленициклопентан, представленный формулой (II), получают из циклопентанона, представленного формулой (IV) реакцией Виттига (Org. Synt. 40, 66 (1966) и I. Org. Chem. 28, (1963), 1128), а затем этиленоксидное производное, представленное формулой (II), может быть получено эпексидированием из полученного таким образом соединения (Org. Synt. Coll. vol. 4, 552 (1963), 49, 62 (1969)).

Схема реакций согласно А - методу и В методу представлена ниже.

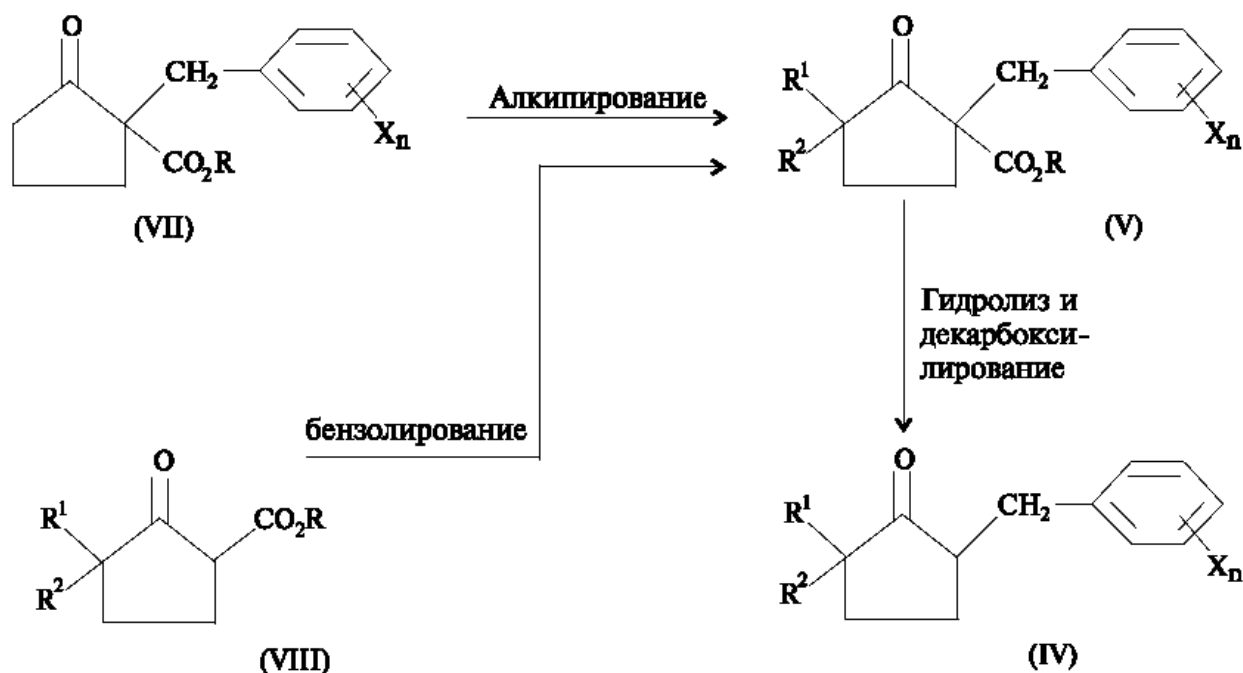
Способы получения оксиранового производного, представленного формулой (II):



Кроме того, производное цикlopentanона, представленное формулой (IV), может быть получено следующим способом. А именно, в случае, если R¹ и R² в формуле (IV) являются одинаковыми, т.е. алкильными группами с 1 - 5 углеродными атомами, то цикlopentanоновое соединение, представленное формулой (VII), подвергают диалкилированию, превращая его при этом в производное сложного эфира цикlopentanкарбоновой кислоты, представленной формулой (V), и производное сложного эфира, представленное формулой (I), подвергают гидролизу и декарбоксилированию, а в том случае, когда только один из R¹ и R² является алкильной группой с 1-5 углеродными атомами, а другой является атомом водорода, то желаемую бензильную группу вводят в производное алкилцикло-пентанкарбоксилата, представленное формулой (VIII), чтобы получить производное сложного эфира цикlopentanкарбоновой кислоты, представленное формулой (V), и затем полученное таким образом производное сложного эфира подвергают гидролизу декарбоксилированию. Прделав это, можно получить цикlopentanовое производное, представленное формулой (IV).

Далее в случае, если R¹ и R² в формуле (IV) являются взаимно различными алкильными группами с 1 - 5 углеродными атомами, то после введения различной алкильной группы с 1 - 5 атомами углерода в производное сложного эфира, цикlopentanкарбоновой кислоты, представленное формулой (V), в которой либо R¹ или R² является алкильной группой с 1 - 5 углеродными атомами, а другой (оставшийся) является атомом водорода, полученное производное сложного эфира подвергают гидролизу и декарбоксилированию, получая при этом желаемое производное представленное формулой (IV). Схема реакций получения упомянутого цикlopentanона представлена ниже.

Схема синтеза цикlopentanона формулы (IV)



Соединения, представленные формулами (VII) и (VIII), являются известными соединениями и могут быть получены из сложного алкилового эфира 2-оксоциклопентанкарбоновой кислоты методами, описанными в Org. Syn. 45, 7 (1965) I.Org. Chem. 29, 2781, 1964.

В качестве разбавителя, используемого в реакциях, участвующих в способе получения производного азолы, представленного формулой (I), могут быть, например, использованы углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и т.п.; галоидоуглеводороды, такие как хлористый метилен, хлороформ, четыреххлористый углерод и т.д.; спирты, такие как метанол, этанол и т.д.; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, тетрагидрофуран, диоксан и т.п. и другие, среди которых ацетонитрил, ацетон, диметилформамид, диметилсульфоксид и тому подобные.

Кроме того, в предложенном способе реакцию проводят в присутствии основания или кислоты в дополнение к упомянутому выше разбавителю. В качестве основания, используемого в способе, могут служить, например, карбонаты щелочного металла, такие как карбонат натрия, карбонат калия и тому подобные; гидроокиси щелочного металла, также как гидроокись натрия, гидроокись калия и т.п.; алколяты щелочного металла, такие как метилат натрия, этилат натрия, тетра-бутилат калия и тому подобные; гидриды щелочного металла, такие как гидрид натрия, гидрид калия и тому подобные; алкильные соединения щелочного металла, такие как *n*-бутиллитий и т.д. и другие, такие как триэтиламин, пиридин и т.д.

В качестве кислоты могут быть использованы, например, неорганические кислоты, такие как хлористо-водородная кислота, бромисто-водородная кислота, йодисто-водородная кислота, серная кислота и т.п.; и органические кислоты, такие как муравьиная кислота, уксусная кислота, масляная кислота, пара-толуолсульфокислота и т.д.

С целью ускорения процесса получения азольного производного, например, в случае получения производного сложного эфира циклопентанкарбоновой кислоты, представленного формулой (V), предпочтительно подвергать реакции галоидный алкил или замещенный галоидный бензил с соединением, представленным формулой (VII) или формулой (VIII), растворенным в разбавителе, в присутствии основания как того требуют обстоятельства. Температура реакции может быть необязательно выбрана в интервале от температуры отверждения разбавителя, как растворителя, до его температуры кипения и предпочтительно в пределах 0 - 100°C.

Производное, представленное формулой (IV), может быть получено

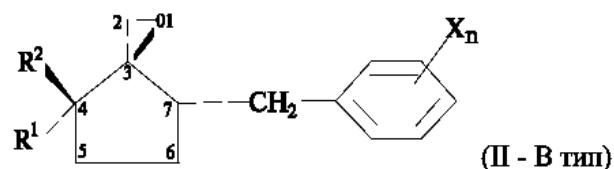
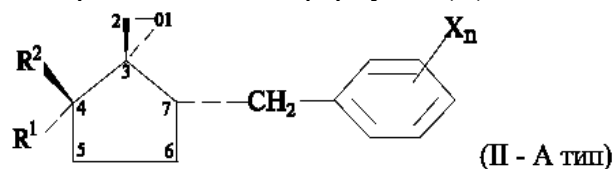
декарбоксилированием производного сложного эфира циклопентанкарбоновой кислоты, представленного формулой (V) при 80 - 150°C с неорганической или органической кислотой в течение 2 - 24 ч, предпочтительно при перемешивании.

Чтобы получить оксирановое производное, представленное формулой (II) в случае применения метода А, предпочтительно добавлять раствор, приготовленный растворением кетона, представленного формулой (IV) в разбавителе (в особенности предпочтителен диметилсульфоксид) к метилиду диметил-тилоксосульфония или к метилиду диметил-сульфония, полученному смешением эквивалентного количества основания (например, гидроксида натрия) и иодида триметил-тилоксосульфонила или иодида триметилсульфония, и дать прореагировать двум соединениям.

В этом случае количество метилида диметил-тилоксосульфония или метилида диметил-сульфония, участвующего в реакции, предпочтительно составляет 1.0 - 2.0 эквивалентных количеств производного циклопентанона, представленного формулой (IV). Реакцию предпочтительно проводят в интервале температур 25 - 100°C и в течение 1 - 40 ч.

В случае получения оксиранового производного методом В производное циклопентанона, представленное формулой (IV), добавляют к метилиду трифенилфосфина (реактив Виттига), приготовленному смешением эквивалентного количества основания (например, гидроксида натрия) и галогенида метилтрифенилфосфония в разбавителе (особенно предпочтителен диметилсульфоксид) и провести реакцию двух соединений в интервале температур 0 - 100°C и в течение времени 2 - 10 ч. Образовавшееся производное метилметиленициклопентанона, представленное формулой (III), выделяют, растворяют в разбавителе и подвергают взаимодействию при (-10)°C до точки кипения разбавителя (-10) - (80)°C после добавления перекиси водорода или органической перекислоты, такой как надуксусная кислота, надбензойная кислота, м-хлорнадбензойная кислота и тому подобные.

Оксирановое производное (соединение II), полученное из производного циклопентанона, представленного формулой (IV), методом А или методом В, дает следующее стереоизо-мерные структуры относительно конформации оксирановой группы в 3- положении и замещенной бензильной группы в положении 1-оксаспиро (2,4)-гептана оксиранового соединения, представленного формулой (II)



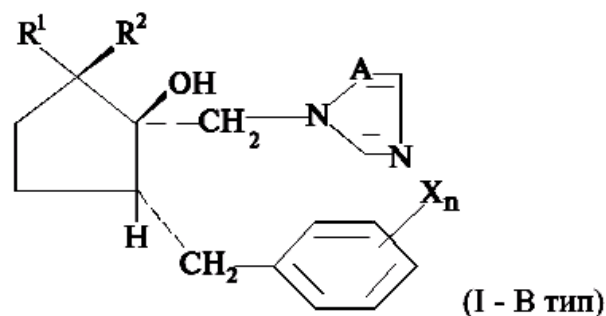
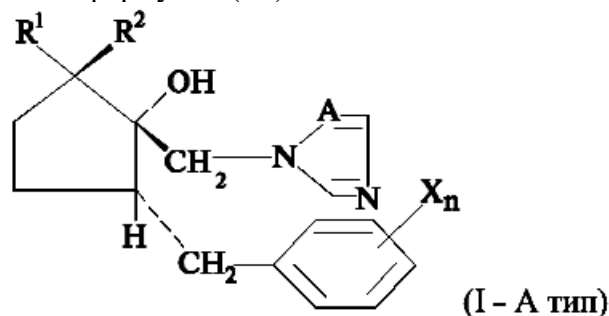
разделение этих изомеров, представленных формулами (II - А) и (II - В), может быть проведено, например, хроматографическими методами (тонкослойная хроматография, колоночная хроматография, высокоэффективная жидкостная хроматография и так далее). Характеристики структуры этих стереоизомеров могут быть найдены, например, спектром ядерного магнитного резонанса.

Чтобы получить азольное производное, представленное формулой (I), оксирановое соединение, представленное формулой (II), добавляют в присутствии основания, требующегося по обстоятельствам, к раствору, приготовленному растворением азольного соединения, представленного формулой (VI), в разбавителе или напротив соль щелочного металла азольного соединения добавляют к раствору, приготовленному растворением

оксиранового соединения в разбавителе, и дают прореагировать двум соединениям. Температура реакции может быть необязательно выбрана в интервале от точки отверждения до точки кипения разбавителя, однако на практике предпочтительно проводить реакцию при 0 - 120°C и более предпочтительно 60 - 120°C в течение 1 - 10 ч при перемешивании.

После завершения реакции полученную таким образом реакционную смесь охлаждали и экстрагировали органическим растворителем, таким как этилацетат, хлороформ, хлористый метилен, бензол и т.д. в ледяной воде. После отделения органического слоя, промывки его водой и сушки промытого слоя растворитель отгоняли при пониженном давлении из органического слоя. Полученный таким образом остаток подвергали очистке и таким образом получали целевое соединение. Очистку осуществляли, подвергая остаток перекристаллизации, хроматографии на силикагеле и тому подобному.

Поскольку существуют два изомера, представленные формулами (II - А) и (II - В) в оксирановом соединении, являющимся исходным соединением для получения азольного производного, представленного формулой (I), то имеют место следующие стереомеры в целевом азольном производном, представленном формулой (I), которое получено реакцией оксиранового соединения, представленного формулой (II) и 1, 2, 4-триазола или имидазола, представленного формулой (VI):



..... - за воображаемой плоскостью;

————— - на воображаемой плоскости;

————— - перед воображаемой плоскостью.

Разумеется, что разделение изомеров, представленных формулами (I- А) и (I- В), может быть выполнено, например, хроматографическими методами.

Полезность азольного производного (азолилциклопентанолового производного), представленного формулой (I) в качестве активного ингредиента композиции для полеводства и садоводства, разъясняется далее.

(I) Фунгицидное действие на грибковые болезни растений.

Производное азола согласно изобретению показывает эффективность в борьбе со следующими болезнями растений в широком диапазоне:

Puricularia orysae	на растениях риса
Cohliobolus mlyabeanus	то же
Xanthomonas oryzae	- " -
Rhizoctonia solani	- " -

<i>Helminthosporium sigmodeum</i>	- " -
<i>Gibberella fijiikuroi</i>	- " -
<i>Podospaera leucotricha</i>	на яблонях
<i>Ventura inaequalis</i>	то же
<i>Scierotinia mail</i>	- " -
<i>Alternaria mail</i>	- " -
<i>Valsa mail</i>	- " -
<i>Alternaria kikuchiana</i>	на грушевых деревьях
<i>Phyllactinia pyri</i>	то же
<i>Gymnosporangium Haraeonum</i>	- " -
<i>Ventura nashicola</i>	- " -
<i>Unccinula necator</i>	на винограде
<i>Phakospora ampepelopsidis</i>	то же
<i>Glomerella cingulata</i>	- " -
<i>Erysiphe graminis f.sp.hordel</i>	на ячмене
<i>Phynchosporium secalis</i>	то же
<i>Puccinia graminis</i>	- " -
<i>Puccinia triformis</i>	- " -
<i>Puccinia recondia</i>	на пшенице
<i>Septoria tritici</i>	то же
<i>Puccinia triformis</i>	- " -
<i>Erysiphe graminis f. sp. tritici</i>	- " -
<i>Sphaerotheca filiginea</i>	на арбузах (дынях)
<i>Colletotrichum lagenarium</i>	то же
<i>Fusarium oxysporum</i>	- " -
<i>Fusarium oxysporum f. cucumerium</i>	на огурцах
<i>Fusarium oxysporum f. raphani</i>	на хрене японском
<i>Erysiphe cichoracearum</i>	на помидорах
<i>Alternaria solani</i>	на помидорах
<i>Erysiphe cichoracearum</i>	на тутовом дереве
<i>Sephaerotheca humili</i>	на землянике
<i>Erysiphe cichoracearum</i>	на табаке
<i>Alternaria longipes</i>	на табаке
<i>Cercospora beticola</i>	на сахарной свекле
<i>Alternaria solani</i>	на картофеле
<i>Septoria glicines</i>	на соевых бобах
<i>Cercospora kikuchil</i>	на сое культурной
<i>Sclerotinia cinerea</i>	на косточковых фруктовых растениях
<i>Botrytis cinerea</i>	на различных культурах
<i>Sclerotinia sclerotiorum</i>	т.д.

Кроме того, азольное производное оказывает не только профилактическое действие, но и также терапевтическое действие на некоторые болезни растений.

(2) Активность в регулировании роста растений

По мере выяснения механизма регулирования роста растений растительными гормонами в практику полеводства и садоводства за последние годы входят химикаты, названные регуляторами роста растений.

Например, получение бессменного винограда с помощью гиббереллина, стимулирование укоренения черенков нафталин-уксусной кислотой и использование хлористого 2-хлорэтилтриметил-аммония (торговое название ССС) в качестве замедлителя роста пшеницы, известно. Кроме того, применение методов регулирования жизненного цикла растений с использованием регуляторов роста растений

распространилась не только на культурные растения, такие как хлебные злаки, овощные растения, фруктовые деревья и т.д., но также и на садовые растения, такие как цветы и другие, и далее на деревья, как растения в широком значении, и функция регуляторов роста растений распространилась на стимулирование укоренения, регулирования цветения, плодоношения, увеличение размеров фруктов, промотирование роста, регулирование роста и регуляция метаболизма.

Следовательно, использование видов и количества средств для регулирования роста растений имеет за последние годы тенденцию роста, однако спрос на средства для регулирования роста растений опережает предложения, не стимулированные в таком объеме, как ожидалось.

Азольное производное (азолилциклопентаноловое производное) согласно изобретению обладает специфическим свойством проявлять различную активность по регулированию роста растений в широких пределах, которое поясняется на следующих примерах:

I) ингибирование вегетативного роста растений, в частности ингибирование роста растений в высоту;

II) повышение активности и содержания полезного компонента растений и

III) активность, регулирующая сроки цветения и сроки созревания растений.

Примером использования ингибирующей рост активности по пункту (I) является ингибирование роста сорняков (гербицидная функция) и дерна; предотвращение полегания растений, подверженных полеганию, таких как рисовые растения, ячмень, пшеница и т.д.; применение механического метода регулирования цветения сои культурной и хлопчатника ингибированием роста в высоту; ингибирование зарождения пазушных почек для стимулирования роста листьев табака; облегчение операции обрезки ингибированием роста живых изгородей; увеличение коммерческой ценности растений задержкой их роста и т.д., который можно привести в подтверждение ингибирующей активности.

Примером использования активности, увеличивающей содержание полезного компонента растений по пункту II), является улучшение качества сахарной свеклы, сахарного тростника и цитрусовых фруктов увеличенным содержанием сахара; повышение качества зерновых культур и сои за счет увеличения содержания белка и т.д. и примером использования регулирующей активности, касающихся сроков созревания фруктов и сроков цветения по пункту III) является приурочение перевозки свежих фруктов и живых цветов к требованиям сезона и др.

Для применения производного азолы, представленного формулой (I), в качестве фунгицидного средства регулятора роста растений само производное или смесь производного и носителя (разбавителя) перерабатывают в порошки, смачивающиеся порошки, гранулы, эмульгирующиеся концентраты, жидкие препараты и т.д. и такие препаративные формы могут быть выгодно применены.

Кроме того, возможно добавление вспомогательных средств для достижения эффекта, таких как смачивающие агенты, эмульгаторы, связующие средства, кроме носителя. Поскольку производное азолы, представленное (I), содержит 1, 2, 4-триазольное кольцо или имидазольное кольцо, то азольное производное может быть использовано в форме кислой аддитивной соли или в форме металлического комплекса. Кроме того, поскольку в производном азоле, представленном формулой (I), азолилметильная группа, алкильная группа с 1 - 5 углеродными атомами и замещенная бензильная группа соответственно находятся в 1-м положении, во 2-м и в 5-м положениях циклопентанового кольца, то могут существовать стереоизомеры, такие как геометрические цис- и транс-изомеры и оптические изомеры, и изобретение включает в свой объем каждый из изомеров и смеси каждого изомера в возможном отношении.

Таким образом, предлагаемая композиция для использования в полеводстве и садоводстве, включает и композиции, содержащие отдельный изомер или смесь изомеров

в качестве активного ингредиента.

Производное азола, представленное формулой (I), обладает высокой активностью в борьбе с болезнями растений и активностью регулятора роста растений и является полезным соединением в качестве активного ингредиента в композиции для полеводства и садоводства.

Эффективность изобретения может быть разъяснена на конкретных примерах композиции для полеводства и садоводства, использующей азольное производное в качестве активного ингредиента, однако изобретение не ограничивается этими примерами.

Примеры получения производного азола, представленного формулой (I), и каждого из промежуточных соединений для получения азольного производного.

Пример 1. Получение метилового эфира 1-(4-хлорбензил)-3,3-диметил-2-оксоциклопентанкарбоновой кислоты, промежуточное соединение 156, представленное в табл.5.

В 150 мл безводного бензола добавляли 5.0 г гидрида натрия (полученного промыванием 60 % масляного гидрида натрия безводным бензолом) при перемешивании в атмосфере гелия и к смеси добавляли 50 г метилового эфира 1-(4-хлорбензил)-2-оксоциклопентанкарбоновой кислоты и смесь перемешивали 40 мин при 80°C. После охлаждения смеси до комнатной температуры к реакционной смеси добавляли 5.0 г гидрида натрия (один эквивалент) и реакционную смесь перемешивали 30 мин при 80°C. После охлаждения реакционной смеси до комнатной температуры к реакционной смеси добавляли 29.4 г йодистого металла (один эквивалент) и реакционную смесь перемешивали 8 ч при 80°C.

После охлаждения реакционной смеси ее выливали в смесь уксусной кислоты и воды со льдом и реакционную смесь экстрагировали этилацетатом для получения органического слоя. После промывки полученного таким образом органического слоя водным раствором кислого карбоната натрия, а затем соевым раствором промытый органический слой сушили на безводном сульфате натрия и растворитель из органического слоя отгоняли при пониженном давлении.

Полученный таким образом остаток подвергали дистилляции при пониженном давлении и очистке и получали 44.8 г целевого соединения (т. кип. 142 - 143°C (0.7 мм Hg)).

Пример 2. Получение 5-(4-хлорбензил)-2,2-диметил-1-циклопентанона (промежуточное соединение 133 показано в табл. 4).

К 120 мл 47 % -и бромисто-водородной кислоты добавляли 44.8 г метилового эфира 1-(4-хлорбензил)-3,3-диметил-2-оксоциклопентанкарбоновой кислоты (соединение 155 показано в табл. 5) и полученную смесь энергично перемешивали 12 ч при 100°C.

После охлаждения реакционной смеси ее переливали в воду со льдом и смесь экстрагировали этилацетатом для получения органического слоя. После промывания органического слоя водным раствором кислого карбоната натрия и затем водным соевым раствором органический слой сушили на безводном сульфате натрия. Отгонкой растворителя из органического слоя при пониженном давлении получали остаток. После дистилляции полученного остатка при пониженном давлении и очистке получали 31 г целевого соединения (т. кип. 124°C (1 мм Hg)).

Пример 3. Получение 5-(4-хлорбензил)-2,2-диметил-1-метиленициклопентана (промежуточное соединение 122, табл. 3).

К 50 мл безводного диметилсульфоксида добавляли 3.6 г гидрида натрия (полученного промыванием 60 % масляного гидрида натрия безводным бензолом) в атмосфере гелия и полученную смесь перемешивали 30 мин при 70°C. После охлаждения реакционной смеси водой со льдом в ней добавляли 53.6 г бромистого метилтрифенилфосфония и полученную смесь перемешивали 30 мин при охлаждении водой со льдом и затем охлажденную смесь перемешивали при комнатной температуре 10 мин. Затем к смеси добавляли 23.6 г 5-(4-хлорбензил)-2,2-диметил-1-циклопентанона (соединение

№133, табл. 4) и полученную смесь перемешивали 1 ч при комнатной температуре и 30 мин при 70°C для завершения реакции.

После охлаждения реакционной смеси ее выливали в воду со льдом и экстрагировали этилацетатом для получения органического слоя. После промывания полученного органического слоя водным солевым раствором промытый органический слой сушили на безводном сульфате натрия, и растворитель отгоняли из сушеного органического слоя при пониженном давлении.

Из полученной смеси маслянистого вещества и твердого вещества маслянистое вещество экстрагировали н-гексаном и полученный н-гексановый экстракт очищали хроматографией на колонке силикагеля и получали 22.1 г целевого соединения.

Пример 4. Получение 7-(4-хлорбензил)-4,4-диметил-1-оксаспиро (2,4) гептана (промежуточное соединение 77 и 78, показанное в табл.2 и полученное методом А).

К 70 мл безводного диметилсульфоксида добавляли 3 г гидрида натрия (полученного промыванием 60 % масляного гидрида натрия безводным бензолом) при перемешивании диметилсульфоксида в атмосфере гелия и затем в полученную смесь добавляли 27.5 г йодистого триметилхлорсульфония. После перемешивания смеси при комнатной температуре в течение 30 мин добавляли к смеси раствор 23.6 г 5-(4-циклобензил)-2,2-диметил-1-циклопентанона (соединение 133, табл. 4) в 20 мл безводного диметилсульфоксида в течение 30 мин и всю смесь перемешивали 2 ч при 90°C.

После охлаждения реакционной смеси ее выливали в воду со льдом и смесь экстрагировали этилацетатом для получения органического слоя. После промывки органического слоя водным солевым раствором органический слой сушили на безводном сульфате натрия, и растворитель отгоняли при пониженном давлении. Полученный остаток подвергали хроматографии на силикагеле и получали 13.95 г целевого соединения 77 и 1.05 г целевого соединения 78.

Пример 5. Получение 7-(4-фторбензил)-4,4-диметил-1-оксаспиро (2, 4) гептана (промежуточное соединение №81 и №82, представленные в табл. 2, получены способом В).

В 170 мл хлороформа растворяли 17 и 5-(4-фторбензил)-2,2 диметил-1-метиленициклопентана (соединение №124, табл.3) и к нему добавляли в течение 10 мин 27.1 г м-хлорнадбензойной кислоты, полученную смесь перемешивали 2 ч при комнатной температуре. Далее к смеси добавляли в течение 10 мин 25.4 г гидроокиси кальция и смесь перемешивали при комнатной температуре 30 мин.

После фильтрования для отделения твердого вещества хлороформовый слой фильтрата конденсировали и получали бесцветный маслянистый материал. Оставшийся маслянистый продукт подвергали хроматографии на колонке силикагеля и получали при этом 4.5 г очищенного целевого соединения 81 и 8.6 г целевого соединения 82.

Пример 6. Получение С-5-(2,4-дихлорбензил)-2,2-диметил-1-(1Н-имидазол-1-ил-метил)-г-1-цикло-пентанола (соединение 15 показано в табл. 1).

В 18 мл безводного диметилформамида добавляли 996 мг гидрида натрия (полученного промыванием 60 % масляного гидрида натрия безводным бензолом) в атмосфере гелия при перемешивании. Далее к полученной смеси добавляли 2.83 г 1Н - имидазола и смесь перемешивали при комнатной температуре до превращения выделения пузырьков газа. К полученному раствору по каплям приливали раствор, полученный растворением 5.93 г 7-(0.2-дихлорбензил)-4,4-диметил-1-оксаспиро (2.4) гептана (соединение 83, табл. 2) в 10 мл безводного диметилформамида и полученную смесь перемешивали 2 ч при 80°C. После охлаждения реакционную смесь выливали в ледяную воду, и полученную смесь экстрагировали этилацетатом для получения органического слоя. После промывки органического слоя водой органический слой сушили безводным сульфатом натрия, и растворитель отгоняли из органического слоя при пониженном давлении.

Полученный остаток подвергали очистке хроматографией на колонке силикагеля и

далее перекристаллизацией из смеси н-гексанэтилацетат. В результате получали 2.7 г целевого соединения.

Пример 7. Получение t-5-(4-хлорбензил)-2,2-диметил-1-(1Н-1,2,4-триазол-1-илметил)-г-1-циклопентанола (соединение 2, табл. 1).

К 30 мл безводного диметилформамида добавляли и растворяли при перемешивании в атмосфере гелия 5.0 г (4-хлорбензил)-4,4-диметил-1-оксаспиро (2,2) гептана (соединение 78, табл. 2) и к полученному раствору медленно добавляли 2.2 г натриевой соли 1Н-1,2, 4-триазола (чистота 90 %, имеется в продаже, поставляется Aldrich Co.). Затем смесь перемешивали 2 ч при 70°C.

После охлаждения полученной реакционной смеси ее выливали в воду со льдом и всю смесь экстрагировали этилацетатом, чтобы получить органический слой. После промывки органического слоя водой органический слой сушили на безводном сульфате натрия, и растворитель отгоняли из осушенного органического слоя при пониженном давлении. Полученный остаток подвергали очистке хроматографией на колонке силикагеля и получали 3.1 г целевого соединения.

Пример 8. Получение 2-(4-хлорбензил)-5-метил-1-циклопентанона промежуточное соединение 137, табл.4).

К 126 мл безводного бензола добавляли 3.04 г гидрида натрия (полученного промыванием 60 % масляного гидрида натрия безводным бензолом) и затем 18 г метилового эфира 3- метил-2-оксоциклопентанкарбоновой кислоты добавляли к полученной смеси. После перемешивания смеси в течение 1 ч при комнатной температуре к смеси добавляли 21.5 г хлористого 4-хлорбензила, и полученную смесь нагревали с обратным холодильником 6 ч на масляной бане при 90°C.

После охлаждения реакционной смеси ее экстрагировали бензолом и бензольный слой промывали водным солевым раствором. После сушки бензольного слоя на безводном сульфате натрия растворитель отгоняли из осушенного бензольного слоя при пониженном давлении, получали 33.6 г желтовато- коричневого маслянистого продукта - метилового эфира 1-(4-хлорбензил)-3-метил-2-оксоциклопентанкарбоновой кислоты (промежуточное соединение 160, табл. 5).

Без очистки в полученный сложный эфир добавляли 100 мл 47 % бромистоводородной кислоты и образовавшуюся смесь энергично перемешивали 18 ч при 110°C. После охлаждения реакционной смеси ее экстрагировали хлористым метиленом и органический слой промывали водным раствором карбоната натрия, и затем водным солевым раствором. Промытый органический слой сушили на безводном сульфате натрия, и растворитель отгоняли из органического слоя при пониженном давлении. Полученный остаток очищали дистилляцией при пониженном давлении и получали 17.4 г целевого соединения.

Пример 9. Получение метилового эфира 1-(4-хлорбензил)-3-этил-3-метил-2-оксоциклопентанкарбоновой кислоты (промежуточного соединения 178, табл. 5).

К 80 мл безводного тетрагидрофурана добавляли при перемешивании в атмосфере гелия 1.7 г гидрида натрия (полученного промыванием 60 % масляного гидрида натрия) и затем к полученной смеси добавляли 18.2 г метилового эфира 1-(4-хлорбензил)-3-метил-2-оксоциклопентанкарбоновой кислоты (промежуточное соединение 160, табл. 5) всю смесь перемешивали 2 ч при комнатной температуре. После этого к смеси добавляли по каплям 11.1 г йодистого этила, поддерживая температуру смеси в пределах 20-30°C, и затем всю смесь перемешивают 1 ч при температуре 20-30°C и в дальнейшем еще 1 ч при 60°C.

После охлаждения реакционную смесь выливали в смесь уксусной кислоты и ледяной воды, и смесь экстрагировали этилацетатом для получения органического слоя. После промывки органического слоя водным раствором кислого карбоната натрия, а затем водным солевым раствором промытый органический слой сушили на безводном сульфате натрия, и растворитель отгоняли из осушенного органического слоя при пониженном давлении.

Полученный остаток очищали дистилляцией при пониженном давлении и получали 15 г целевого соединения.

Пример 10. Получение 4-(4-хлорбензил)-7-метил-1-оксаспиро-(2,4)-гептана (промежуточное соединение 85, табл. 2). К 37 мл безводного диметилсульфоксида добавляли при перемешивании в атмосфере гелия 1.44 г гидрида натрия (полученного промывкой 60 % масляного гидрида натрия безводным бензолом) и к полученной смеси добавляли 13.2 г йодистого триметилорсо-сульфония и всю смесь перемешивали 30 мин при комнатной температуре. Далее к смеси за 10 мин добавляли раствор 12.2 г 2-(4-хлорбензил)-5-метил-1-циклопентанона (соединение 137, табл. 4) в 12 мл безводного диметилсульфоксида и полученную смесь перемешивали 4 ч при комнатной температуре.

Полученную реакционную жидкость выливали в воду со льдом, и смесь экстрагировали хлористым метиленом для получения органического слоя. После промывки водным соляным раствором органический слой сушили на безводном сульфате натрия и растворитель из органического осушенного слоя отгоняли при пониженном давлении.

Полученный остаток очищали хроматографией на колонке силикагеля и получали 6.67 г целевого соединения.

Кроме того, выделены кроме целевого соединения еще три вида изомеров целевого соединения, а именно 0.15 г промежуточного соединения 86, 0.16 г промежуточного соединения 87 и 0.16 г промежуточного соединения 88 (табл. 2).

Пример 11. Получение 4-(4-хлорбензил)-7-этил-1-оксаспиро (2,4)-гептана (промежуточное соединение 93- 96, табл. 2). В 100 мл хлороформа растворяли 8.0 г 2-(4-хлорбензил)-5-этил-1-метил енциклопентана (соединение 129, табл. 3) и в течение 5 мин к полученному раствору добавляли 11.6 г м-хлорнадбензойной кислоты и всю смесь перемешивали 2 ч при комнатной температуре. К смеси при охлаждении ледяной водой добавляли 11 г гидроокси кальция и смесь перемешивали при комнатной температуре 30 мин.

Выделившееся твердое вещество изолировали фильтрацией, хлороформовый слой фильтрата концентрировали до получения бесцветного маслянистого продукта. Маслянистое вещество очищали хроматографией на колонке силикагеля и получали 0.7 г соединения 93; 2.4 г соединения 94; 2.2 г соединения 95 и 2.6 г соединения 96, указанных в названии примера.

Пример 12. Получение С-2-(4-хлорбензил)-5-метил-1-(1Н-1,2,4-триазол-1-илметил)-г-1-циклопентанола (соединение 16, табл.1). К 10 мл безводного диметилформамида добавляли 630 мг гидрида натрия (полученного промыванием 60 % масляного гидрида натрия безводным бензолом) и затем к смеси добавляли 1.8 г 1Н-1, 2, 4-триазола и всю смесь перемешивали при комнатной температуре до прекращения выделения пузырьков газа.

В полученную реакционную смесь добавляли раствор 3.1 г 4-(4-хлорбензил)-7-метил-1-оксаспиро (2,4) гептана (соединение 85, табл. 2) в 6.2 мл безводного диметилформамида и образовавшуюся смесь перемешивали 1 ч при 80°C. После охлаждения полученной реакционной жидкости, ее выливали в воду со льдом, и полученную смесь экстрагировали хлористым метиленом для получения органического слоя. После промывки органического слоя водным соевым раствором его сушили на безводном сульфате натрия, и растворитель отгоняли из органического слоя при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке силикагеля и далее перекристаллизацией из смеси н-гексанэтилацетат и получали 2.83 г целевого соединения.

Пример 13. Получение С-2(4- хлорбензил)-5-метил-1-(1Н-имидазол-1-илметил-г-1-циклопентанола (соединение 17, табл. 1). К 10 мл безводного диметилформамида добавляли 670 мг гидрида натрия (полученного промыванием 60 % масляного гидрида натрия) и затем добавляли 1.9 г 1 н-имидазола и смесь перемешивали при комнатной

температуре до тех пор, пока не осветлила реакционная смесь. Далее к смеси добавляли раствор 3.3 г 4-(4-хлорбензил)-7-метил-1-оксаспиро (2,4) гептана (соединение 85, табл. 2) в 6.6 мл безводного диметилформамида и смесь перемешивали 1 ч при 80°C. После охлаждения реакционную смесь выливали в воду со льдом и полученную смесь экстрагировали хлористым метилом для получения органического слоя. После промывки органического слоя водным соевым раствором органический слой сушили на безводном сульфате натрия и отгоняли растворитель из органического слоя при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на силикагеле и далее перекристаллизацией из смеси н-гексан-этилацетат и получали 3.16 г целевого соединения.

Примеры получения фунгицидных композиций для применения в полеводстве и садоводстве.

Пример 14. Дуст (порошок).

Три весовых части азольного производного (соединение 3), 40 вес. ч. глины и 57 вес. ч. талька смешивали и измельчали в порошок для приготовления фунгицидной композиции, применяемой в полеводстве и садоводстве в форме дуста.

Приготовленную композицию применяли путем распыления.

Пример 15. Смачивающийся порошок.

Пятьдесят весовых частей производного азола (соединение 1), 5 вес. ч. соли лигнин-сульфокислоты, 3 вес. ч. алкилсульфокислоты и 42 вес. ч. диатомовой земли смешивали и измельчали в порошок для получения смачивающегося порошка.

Приготовленную композицию применяли в качестве смачивающегося порошка после разведения водой.

Пример 16. Гранулы.

Пять вес. ч. азольного производного (соединение 16), 43 вес. ч. бентонита, 45 вес. ч. глины и 7 вес. ч. соли лигнинсульфокислоты гомогенно смешивали и после добавления воды перемешивали, придавали форму гранул на экструзионном грануляторе и сушили для получения композиции в форме гранул.

Пример 17. Эмульгирующий концентрат. Двадцать вес. ч. производного азола (соединение 13), 10 вес. ч. алкиларилового эфира полиоксиэтилена, 3 вес.ч. монолаурата полиоксиэтиленсорбитана и 67 вес. ч. ксилола гомогенно смешивали и готовили композицию в форме эмульгирующегося концентрата.

Примеры применения фунгицидной композиции для полеводства и садоводства в борьбе против болезней растений.

Пример 18. Испытания на эффективность в борьбе с *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* на пшенице.

На молодые всходы пшеницы в стадии второго листа (вид: Norin №64, по 16 растений на горшок и 3 горшка на опытной делянке), которые выращивали с использованием неглазурованных горшков диаметром 10 см, наносили по 5 мл на горшок по примеру 15 (разбавленный водой до заранее заданной концентрации). После просыхания на воздухе нанесенного разбавленного концентрата на всходы в горшках наносили разбрызгиванием суспензии летних спор *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, которые собирали на пораженных листьях пшеницы, и горшки выдерживали при 20 - 24°C в течение 24 ч в условиях высокой влажности и затем горшки оставляли в теплице. На 10-й и 12-й день после заражения распространение заболевания на всходах пшеницы оценивали в соответствии со следующими стандартами и эффективность фунгицидной композиции рассчитывали согласно следующей формуле (экспериментальные стандарты):

Степень заболевания	Распространенные болезни
0	Растения не повреждены грибом
0.5	Пятнистость составляет менее 10 % поверхности

1	Пятнистость более 10 %, не менее 20 % поверхности
2	Пятнистость более 20 %, но ниже 40 % поверхности
3	Пятнистость более 40 %, но ниже 60 % поверхности
4	Пятнистость более 60 %, но ниже 80 % поверхности
5	Пятнистость занимает более 80 % поверхности

$$\text{Эффективность} = \left(1 - \frac{\text{степень заболевания обработанных растений}}{\text{степень заболевания контрольных растений}} \right) \times 100 \%$$

Данные приведены в табл. 6.

Пример 19. Испытание эффективности в борьбе с *Sp. Macrotheca filiginea* на огурцах.

На растениях огурцов в стадии второго листа (сорт: Sagami Hampraku, одно растение в горшке и по 3 горшка на опытной делянке), которые выращивали в неглазурованных горшках диаметром 10 см, наносили по 5 мл на горшок водной суспензии смачивающегося порошка, полученного в примере 15 (разбавленный водой до заранее заданной концентрации). После сушки листьев на воздухе из них наносили с помощью кисти споры *Sphacrotheca filiginea* с пораженных болезнью листьев огурцов для заражения опытных растений огурцов, и болезнь была вызвана на растениях, содержащихся в теплице.

Через 9 и 11 дней после заражения исследовали степень заболевания растений огурцов, руководствуясь следующими экспериментальными стандартами, эффективность фунгицидной композиции рассчитывали по следующей формуле (экспериментальные стандарты):

Степень заболевания	Распространенность заболевания:
0	Растения не повреждены грибом
0.5	Пятнистость занимает не более 10 %
1	Пятнистость занимает более 10 %, но не превышает 20 % поверхности
2	Пятнистость занимает более 20 %, но не превышает 40 % поверхности
3	Пятнистость составляет более 40 %, но не более 60 % поверхности
4	Пятнистость занимает более 60 %, но не более 80 % поверхности
5	Пятнистость занимает более 80 % поверхности

$$\text{Эффективность} = \left(1 - \frac{\text{степень заболевания обработанных растений}}{\text{степень заболевания растений в контроле}} \right) \times 100 \%$$

Результаты испытаний приведены в табл. 7.

Пример 20. Испытание на эффективность против *russinia recondita* на пшенице.

На молодые всходы пшеницы в стадии второго листа (сорт Norin 64, по 16 растений на горшок, по три горшка на опытной делянке), которые выращивали в неглазурованных горшках диаметром 10 см, наносили разбрызгиванием 5 мл на горшок водной суспензии смачивающегося порошка, приготовленного по примеру 15 (разбавленного водой до заранее заданной концентрации).

После сушки нанесенного состава на воздухе на всходы в горшках наносили разбрызгиванием суспензию летних спор *russinia recondita*, собранных со сморщенных листьев пшеницы, и горшки содержали при 20 - 23°C в течение 24 ч в условиях высокой влажности, а затем горшки оставляли в теплице. Через 7 и 11 дней после заражения распространенность заболевания на растениях пшеницы исследовали, руководствуясь следующими экспериментальными стандартами, и эффективность фунгицидной композиции рассчитывали согласно следующей формуле, исходя из средней степени

заболевания на лист (экспериментальные данные):

Степень заболевания	Распространенность болезни:
0	Поражения грибом не обнаружено
0.5	Пятнистость занимает менее 10 % поверхности
1	Пятнистость более 10 %, но менее 20 % поверхности
2	Пятнистость более 20 %, но менее 40 % поверхности
3	Пятнистость более 40 %, но выше 60 % поверхности
4	Пятнистость более 60 %, но не выше 80 % поверхности
5	Пятнистость не менее 80 % поверхности листьев

$$\text{Эффективность} = \left(1 - \frac{\text{степень заболевания обработанных растений}}{\text{степень заболевания контрольных растений}} \right) \times 100 \%$$

Результаты испытаний приведены в табл. 8.

Пример 21. Испытание на эффективность против *Botrytis cinerea* на фасоли обыкновенной.

На листья фасоли обыкновенной в стадии первого истинного листа (сорт Nonkintoki), выращенной в неглазурованных горшках диаметром 10 см, наносили по 5 мл на горшок, разбавленный эмульгирующий концентрат состава, описанного в примере 15 (разбавленного водой до заранее заданной концентрации) путем разбрызгивания.

После просыхания на воздухе нанесенного состава на листья непосредственно приклеивали в центральной части листа растений фасоли обыкновенный круглый срез агара диаметром 4 мм, содержащий грибки *Botrytis cinerea*, которые предварительно выращивали в течение трех дней при 20°C с использованием агаровой среды с добавлением сахара, содержащей картофельный бульон, и растения выдерживали при 20 - 22°C в условиях высокой влажности. На третий день после заражения область обусловленной болезнью пятнистости обработанных таким образом растений сравнивали с состоянием контрольных растений (необработанных) для изучения степени заболевания, руководствуясь следующими экспериментальными стандартами, и эффективность фунгицидной композиции рассчитывали по следующей формуле (экспериментальные стандарты):

Степень заболевания	Распространенность болезни:
0	Растения не подвержены заболеванию
0.5	Поражена только часть листа, как раз под инокулированным, содержащим грибки агаром и на его периферийной части
1	Пятнистость занимает менее 20 % поверхности
2	Пятнистость занимает более 20 %, но меньше 40 %
3	Пятнистость не менее 40 %, но и не более 60 %
4	Пятнистость не менее 60 %, но не более 80 %
5	Пятнистость занимает не менее 80 % поверхности

$$\text{Эффективность} = \left(1 - \frac{\text{степень заболевания обработанных растений}}{\text{степень заболевания контрольных растений}} \right) \times 100 \%$$

Результаты испытаний приведены в табл. 9.

Пример 22. Испытание эффективности фунгицидной композиции против *Cochliobolus miyabeanus* на растениях риса.

В каждый неглазурованный горшок диаметром 10 см высевали по 16 семян риса

(сорт Sasanishiki), и когда рассада риса достигала стадии 4-5 листа, наносили 5 мл 1 горшок водной суспензии смачивающегося порошка, описанного в примере 15 (разбавленного водой до заранее заданной концентрации).

После сушки на воздухе обработанных таким образом листьев на них наносили разбрызгиванием суспензии спор *Cochliobolus miyabeanus*, заранее выращенных для этой цели из расчета 5 мл на горшок. Под микроскопом со 150-кратным увеличением в поле микроскопа находили в суспензии 15 спор грибов.

Сразу же после заражения обработанные таким образом горшки оставляли в камере инокулирования на два дня в условиях высокой влажности при 25°C, после чего их переносили в теплицу для продолжения эксперимента. На пятый день после заражения подсчитывали количество пятен болезни на 10 листьях на каждом горшке и эффективность фунгицидной композиции рассчитывали по следующей формуле:

$$\text{Эффективность} = \left(1 - \frac{\text{число пятен болезни на обработанной делянке}}{\text{число пятен болезни на необработанной делянке}} \right) \times 100 \%$$

Результаты испытаний представлены в табл. 10.

Пример 23. Фунгицидные испытания против некоторых патогенных грибов.

Этот пример показывает результаты испытаний фунгицидных свойств азольного производного против различных патогенных для растений грибов.

Метод испытаний.

Соединение растворяли в диметил-сульфоксиде с тем, чтобы получить раствор с заранее заданной концентрацией, и 0.6 мл полученного раствора тщательно смешивали с 60 мл PAS-культуральной среды при 60°C в конической колбе емкостью 100 мл. Полученную смесь выливали в стеклянные чашки для культивирования и отверждали как однородную культуральную среду, содержащую соединение.

С другой стороны испытуемые грибки, которые заранее были выращены в однородной культуральной среде, захватывали пробковым сверлом диаметром 4 мм и взятый таким образом кусочек культуральной среды, содержащий испытуемый грибок, инокулировали в однородной культуральной среде, содержащей испытуемое соединение. После прививки полученную культуральную среду, содержащую испытуемое соединение и грибок выращивали 1-3 дня при подходящей температуре для роста каждого грибка, и рост грибов измеряли по диаметру грибковой колонии. При сравнении роста грибов в приготовленной таким образом культуральной среде с ростом грибов в культуральной среде, не содержащей испытуемого соединения, степень ингибирования роста мицелия грибов определяли по следующей формуле:

$$R = (dc - dt) 100 / dc,$$

где R - степень ингибирования роста мицелия;

dc - диаметр колонии грибка в среде, не содержащей соединения;

dt - диаметр колонии грибка в среде, содержащей испытуемое соединение.

Результаты оценивали по пятибалльной системе согласно следующим стандартам (см. табл. 11). Степень ингибирования роста мицелия:

- 5 - степень ингибирования роста мицелия не менее 90- 100 %;
- 4 - степень ингибирования роста мицелия не менее 70 % и не более 90 %;
- 3 - степень ингибирования роста мицелия не менее 40 % и не более 70 %;
- 2 - степень ингибирования роста мицелия не менее 20 % и не более 40 %;
- 1 - степень ингибирования роста мицелия не превышает 20 % .

P.O.: *Puricularia orisae*

C.M.: *Cochliobolus miyabeanus*

G.F.: *Gibberella fujikuroi*

H.S.: *Helminthosporium sigmodeum*

R.S.: *Rhizoctonia solani*

Bo.C.: *Botrytis cinerea*

На растениях риса

Тоже

- " -

- " -

- " -

На различных культурах

S.S.: Sclerotinia sclerotiorum	- " -
F.N.: Fusarium oxysporum f. niveum	На арбузе
F.C.: Fusarium oxysporum f., cucumerium	На огурцах
F.r.: Fusarium oxysporum f. raphani	На хрене японском
C.L.: Colletotrichum lagenarium	На дыне
C.b.: Cercospora beticola	На сахарной свекле
S.C.: Sclerotinia cinerea	На персике обыкновенном
V.m. : Valsa mali	На яблонях
A.m. : Alternaria mali	На яблонях
A.L.: Alternaria alternata	На грушевых деревьях
G.c.: Glomerella cingulata	На винограде

Примеры композиций для использования в полеводстве и садоводстве, регулирующих рост растений, содержащий азольное производное в качестве активного ингредиента.

Пример 24. Форма смачивающегося порошка.

50 вес. ч. азольного производного (соединение 3, табл. 1), 5 вес. ч. соли лигнин-сульфоокислоты, 3 вес.ч. соли алкилсульфоокислоты и 42 вес.ч. диатомовой земли смешивали и измельчали в порошок для получения композиции в форме смачивающегося порошка. Композицию использовали после разбавления водой.

Пример 25. Форма эмульгирующегося концентрата. 25 вес.ч. азольного производного (соединение 20, табл. 1), 65 вес. ч. ксилола и 10 вес. ч. алкиларилового эфира полиокси-этилена гомогенно смешивали для получения композиции в форме эмульгирующегося концентрата. Композицию следует использовать после разбавления водой.

Пример 26. Форма дуста (порошка).

8 вес. ч. азольного соединения (11, табл. 1), 40 вес. ч. бентонита, 45 вес. ч глины и 7 вес. ч. соли лигнинсульфоокислоты гомогенно смешивали и придавали форму гранул с помощью экструзионного гранулятора и гранулированный материал сушили для получения композиции в форме дуста (здесь имеет место смешение технологии получения дуста и гранул).

Пример 27. Эффекты ограничения роста растений риса в высоту.

В каждую стеклянную чашку диаметром 8.5 см вводили по 10 мл раствора, содержащего каждое из соединений в концентрации 10 мил. долей и высевали по 10 семян риса (сорт Sasanishiki) в стеклянную чашку. Чашки содержали в комнате при 27°C в течение 7 дней, чтобы получить всходы риса и затем измеряли высоту сеянцев, чтобы получить данные, представленные в табл. 12.

Как видно из данных табл. 12, каждое из производных азола, привлеченных к этим испытаниям, показало эффект ограничения роста в высоту без какой-либо фитотоксичности.

Пример 28. Эмульгирующий концентрат, вес. ч.:

Соединение формулы 1	10
Тензиофикс Gs (торговая марка фирмы Гензия Ко.)	3.5
Тензиофикс Ns ("")	6.5
Циклогексанон	15
Ксилол	65

Ингредиенты объединялись и перемешивались, образуя эмульгирующий концентрат.

Пример 29. Испытание на эффект подавление Erysiphe graminis f. sp. tritici на пшенице проводили с помощью процедуры, по примеру 18, за исключением применения 5 мл на горшок разбавленного эмульгирующего концентрата, полученного согласно примеру 17, вместо применения 5 мл на горшок водной суспензии смачиваемого порошка. Результаты показаны в табл. 13 (номера соединений, показанные в следующих таблицах,

являются номерами, приведенными в табл. 1).

Пример 30. Испытание на эффект подавления *Puccinia recondita* на пшенице.

Использовали процедуру по примеру 20 за исключением применения 5 мл на горшок разбавленного эмульгирующего концентрата, полученного согласно примеру 17, вместо применения 5 мл на горшок водной суспензии смачиваемого порошка.

Результаты показаны в табл. 14.

Пример 31. Испытание на эффект подавления *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* на пшенице.

Использовали процедуру примера 18, за исключением 5 мл на горшок разбавленного эмульгирующего концентрата, полученного согласно примеру 28, вместо 5 мл на горшок водной суспензии смачиваемого порошка. Результаты приведены в табл. 15.

Пример 32. Испытание на эффект подавления *Puccinia recondita* на пшенице.

Использовали процедуру по примеру 20, за исключением применения 5 мл на горшок разбавленного эмульгирующего концентрата, полученного согласно примеру 28, вместо 5 мл водной суспензии смачиваемого порошка. Результаты приведены в табл. 16.

Пример 33. Эффект сдерживания высоты растений на растениях риса.

Использовали процедуру примера 27, за исключением того, что вводили водные суспензии смачиваемого порошка, полученного согласно примеру 24, в концентрации 10 част./млн, вместо раствора, содержащего каждое из соединений согласно изобретению с концентрацией 10 част./млн.

Результаты показаны в табл. 17. Все испытанные соединения не обнаруживали каких-либо признаков токсичности по отношению к растениям риса.

Пример 34. Испытание на эффект подавления *Puccinia recondita* на пшенице проводили с использованием процедуры примера 20, за исключением применения 3 кг/га дуста, приготовленного согласно примеру 14, вместо применения 5 мл на горшок водной суспензии смачиваемого порошка. Результаты приведены в табл. 18.

Пример 35. Испытание на эффект подавления *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* на пшенице проводили с использованием процедуры примера 18, за исключением применения 3 кг на 1 га дуста, приготовленного согласно примеру 14, вместо применения 5 мл на горшок водной суспензии смачиваемого порошка. Результаты приведены в табл. 19.

Пример 36. Испытание гранул на эффект подавления *Puccinia recondita* на пшенице проводили с использованием процедуры примера 20, за исключением применения 3 кг/га гранул, полученных согласно примеру 16, на молодых сеянцах пшеницы в стадии первого листа, вместо применения 5 мл на горшок водной суспензии смачиваемого порошка на молодых сеянцах пшеницы в стадии второго листа. Результаты показаны в табл. 20.

Пример 37. Испытание гранул на эффект подавления *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* на пшенице проводили с использованием процедуры примера 18, за исключением применения 3 кг на 1 га гранул, приготовленных согласно примеру 16, на молодых сеянцах пшеницы в стадии первого листа, вместо применения 5 мл на горшок водной суспензии смачиваемого порошка на молодых сеянцах пшеницы в стадии второго листа. Результаты приведены в табл. 21.

Пример 38. Эффект гранул по сдерживанию роста растений в высоту на растениях риса.

Семена растений риса (разновидность САСАНИСИКИ) проращивались в ящике для рассады (300 x 600 x 30 мм) и выращивались до первоначальной стадии появления зеленой массы. На сеянцы равномерно раскидывались 25 г на ящик гранул, полученных согласно примеру 16. Обработанные сеянцы хранились в теплице в течение 14 дней и вычислялись показатели сдерживания высоты растений в соответствии со следующим уравнением.

Показатель сдерживания высоты растений, % :

$$\left(1 - \frac{\text{Высота обработанных растений}}{\text{Высота необработанных растений}} \right) \times 100\%$$

Результаты представлены в табл. 22.

Пример 39. Влияние эмульгирующего концентрата по сдерживанию роста в высоту на растениях риса. Повторяли процедуру примера 38, но использовали 500 мл на ящик разбавленного эмульгирующего концентрата, приготовленного в соответствии с примером 25. Результаты приведены в табл. 23.

Пример 40. Эффект дуста по сдерживанию высоты растений на растениях риса.

Семена растений риса (разновидность САСАНИСИКИ) опылялись в количестве 0.5 мас. % в расчете на сухой вес семян дустом, приготовленным согласно примеру 26. Обработанные семена проращивались в ящике для выращивания рассады размером 300 x 600 x 30 мм и после этого - в теплице в течение 14 дней. Показатели сдерживания высоты растений вычислялись таким же образом, как в примере 38. Результаты показаны в табл. 24.

Пример 41. Испытание на эффект подавления *Ruscinia recondita* на пшенице. Названные испытания проводились с использованием процедуры примера 20, за исключением того, что применялось 5 мл на горшок водной суспензии смачиваемого порошка соединения, показанного в табл. 25 и 26, вместо смачиваемого порошка по примеру 15.

Пример 42. Испытание на эффект подавления *Botrytis cinerea* на фасоли обыкновенной проводились с использованием примера 21, за исключением применения 5 мл на горшок водной суспензии смачиваемого порошка соединения, показанного в табл. 26, вместо смачиваемого порошка по примеру 15.

Пример 43.

Смачиваемый порошок	мас. ч.
Соединение формулы 1	80
Синтетическая аморфная двуокись кремния	3
Каолинит	13
Алкилнафталинсульфонат натрия	2
Лигнинсульфонат натрия	2

Ингредиенты смешивались с образованием смачиваемого порошка.

Пример 44.

Дуст	мас. ч.
Соединение формулы 1	1
Каолинит	99

Ингредиенты смешивались и пульверизовались с образованием дуста.

Пример 45.

Эмульгируемый концентрат	мас.ч.
Соединение формулы 1	40
Циклогексанон	15
Ксилол	25
Додецилбензолсульфонат натрия	8
Бутилфенол-полиэтилен-гликолевый эфир (36 моль окиси этилена)	12

Ингредиенты объединялись и перемешивались с образованием эмульгируемого концентрата.

Пример 46. Испытание на эффект подавления *Ruscinia recondita* на пшенице проводили с использованием процедуры примера 20, за исключением применения смачиваемого порошка примера 43 вместо смачиваемого порошка, полученного по примеру 15. Результаты показаны в табл. 27.

Испытание на эффект подавления *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* на пшенице.

Названные испытания проводились с использованием процедуры примера 18, за

исключением применения смачиваемого порошка, полученного в примере 43, вместо смачиваемого порошка, полученного по примеру 15.

Результаты показаны в табл.28.

Эффект сдерживания высоты растений на растениях риса.

Семена растений риса (разновидность: САСАНИСИКИ) проращивались в ящике для выращивания рассады размером 300 x 600 x 300 мм до начальной стадии появления зелени. Разбавленный смачиваемый порошок, полученный в примере 43, разбавленный водой до заданной концентрации в количестве 500 мл на ящик равномерно распылялся на сеянцах.

Обработанные сеянцы хранились в теплице в течение 14 дней и показатели сдерживания высоты растений вычислялись согласно следующему уравнению.

Показатель сдерживания высоты растений, % :

$$\left(1 - \frac{\text{Высота обработанных растений}}{\text{Высота необработанных растений}} \right) \times 100\%$$

Результаты показаны в табл. 29.

Пример 47. Испытание на эффект подавления *Puccinia recondita* на пшенице проводили с использованием процедуры примера 20, за исключением того, что применялся порошок, приготовленный в примере 44, вместо смачиваемого порошка, полученного в примере 15. Результаты показаны в табл. 30.

Испытание на эффект подавления *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* на пшенице проводились с использованием процедуры примера 18, за исключением применения порошка, приготовленного по примеру 44, вместо смачиваемого порошка, полученного в примере 15. Результаты показаны в табл. 31.

Эффект сдерживания высоты растений на растениях риса при применении дуста.

Семена растений риса (разновидность: САСАНИСИКИ) опылялись порошком, полученным в примере 44, в количестве 0.5 мас. % в расчете на сухой вес семян. Обработанные семена проращивались в ящике для выращивания рассады размером 300 x 600 x 30 мм и выращивались в теплице в течение 14 дней.

Показатели сдерживания высоты растений вычислялись таким же образом, как в примере 46. Результаты показаны в табл. 32.

Пример 48. Испытания на эффект подавления *Puccinia recondita* на пшенице проводили с использованием процедуры по примеру 20, за исключением применения эмульгируемого концентрата, приготовленного в примере 45, вместо смачиваемого порошка, полученного в примере 15. Результаты показаны в табл. 33.

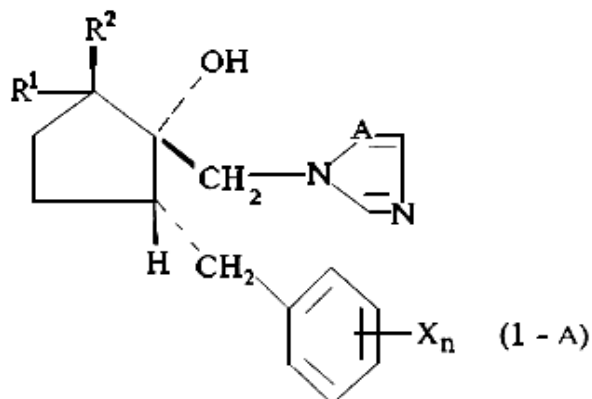
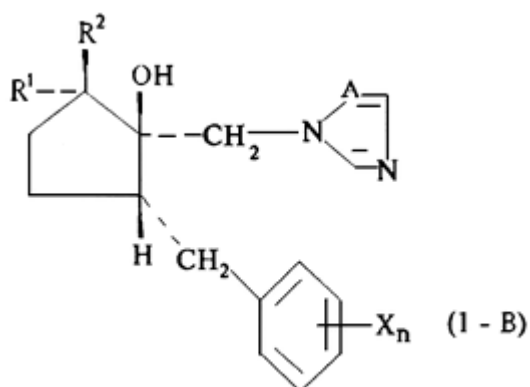
Испытания на эффект подавления *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* на пшенице проводились с использованием процедуры примера 18, за исключением применения эмульгируемого концентрата, полученного в примере 45, вместо смачиваемого порошка, полученного в примере 15. Результаты показаны в табл. 34.

Эффект сдерживания роста растений на растениях риса.

Семена растений риса (разновидность: САСАНИСИКИ) проращивались в ящиках для выращивания рассады размером 300 x 600 x 300 мм до начальной стадии появления зелени. Разбавленный эмульгируемый концентрат, полученный в примере 45, (разбавленный водой до заданной концентрации) в количестве 500 мл на ящик равномерно разбрызгивался на сеянцы.

Обработанные сеянцы хранились в теплице в течение 14 дней и вычислялись показатели сдерживания высоты растений таким же образом, как в примере 46. Результаты представлены в табл. 35.

Таблица 1



Соединение	Радикалы в формуле(I)				Тип стереоизомера	Т. пл., °C	Спектр ЯМР (CDCl ₃ , млн. д.)
	R ¹	R ²	X _n	A			
1	CH ₃	CH ₃	4-Cl	N	А-тип	113-114	0.60 (с, 3H); 1.00 (с, 3H); 1.07~1.90 (м, 5H); 2.33 (ш.с., 2H); 3.53 (с, 1H); 4.13 (с, 2H); 6.80~7.24 (м, 4H); 7.83 (с, 1H); 8.02 (с, 1H)
2	CH ₃	CH ₃	4-Cl	N	В-тип	113-114	0.82 (с, 3H); 1.00 (с, 3H); 1.23-1.93 (м, 4H); 2.07-2.48 (м, 2H); 2.85~3.07 (м, 1H); 3.90 (с, 1H); 4.37 (с, 2H); 7.03 (д, 2H, S=8); 7.25 (д, 2H, S=8); 7.97 (с, 1H); 8.27 (с, 1H)
3	CH ₃	CH ₃	4-Cl	CH	А-тип	133-134	0.80 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 1.13~2.93 (м, 8H); 3.97 (с, 2H); 7.02 (с, 2H); 6.80~7.33 (м, 4H); 7.60 (с, 1H)
4	CH ₃	CH ₃	4-Cl	CH	В-тип	133-134	0.83 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 1.13~3.13 (м, 8H); 4.03 (с, 2H); 6.70~7.23 (м, 6H); 7.63 (с, 1H)
5	CH ₃	CH ₃	4-Br	N	А-тип	129-130	0.63 (с, 3H); 1.00 (с, 3H); 1.13 ~ 1.93 (м, 5H); 2.33 (ш.с., 2H); 3.60 (с, 1H); 4.20 (с, 2H); 6.93~7.50 (м, 4H); 7.97 (с, 1H); 8.17 (с, 1H)
6	CH ₃	CH ₃	4-Br	N	В-тип	134-135	0.77 (с, 3H); 0.97 (с, 3H); 1.20~3.03 (м, 7H); 3.80 (с, 1H); 4.33 (с, 2E); 6.87~7.47 (м, 4H); 7.93 (с, 1H); 8.20 (с, 1H)
7	CH ₃	CH ₃	4-Br	CH	А-тип	149-150	0.80 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 1.13~2.53 (м, 8H); 4.00 (с, 2H); 6.80~7.50 (м, 6H); 7.63 (с, 1H)
8	CH ₃	CH ₃	4-Br	CH	В-тип	134-135	0.83 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 1.17~2.97 (м, 8H); 4.03 (с, 2H); 6.70~7.40 (м, 6H); 7.57 (с, 1H)
9	CH ₃	CH ₃	4-F	N	А-тип	135-136	0.67 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 1.17 ~ 2.42 (м, 4H); 2.50 (ш.с., 3H); 3.63 (с, 1H); 4.23 (с, 2H); 6.73-7.33 (м, 4H); 7.93 (с, 1H); 8.13 (с, 1H)
10	CH ₃	CH ₃	4-F	N	В-тип	134-135	0.80 (с, 3H); 1.02 (с, 3H); 1.27~3.10 (м, 7H); 3.90 (м, 1H); 4.37 (с, 2H); 6.73~7.27 (м, 4H); 7.97 (с, 1H); 8.27 (с, 1H)

Продолжение табл. 1

Соединение	Радикалы формуле; (I)				Тип стерео-изомера	Т. пл., °C	Спектр ЯМР (CDCl ₃ , млн. д.)
	R ¹	R ²	Xn	A			
11	CH ₃	CH ₃	4-F	CH	А-тип	131~133	0.83 (с, 3H); 1.07 (с, 3H); 0.90~2.00 (м, 5H); 2.25 (ш.с., 2H); 2.57 (ш.с., 1H); 4.03 (с, 2H); 6.73-7.72 (м, 6H); 7.67 (с, 1H)
12	CH ₃	CH ₃	4-F	CH	В-тип	104~106	0.87 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 1.17~3.03 (м, 8H); 4.10 (с, 2H); 6.70~7.27 (м, 6H); 7.73 (ш.с., 1H)
13	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂	N	А-тип	126~127	0.56 (с, 3H); 1.01 (с, 3H); 0.79~2.79 (м, 5H); 2.66 (ш.с., 2H); 2.97 (с., 1H); 4.27 (с, 2H); 7.2 (ш.с., 2H); 7.28 (ш.с., 1H); 7.92 (с, 1H); 8.12 (с, 1H)
14	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂	N	В-тип	108~110	0.80 (с, 3H); 1.02 (с, 3H); 1.25~1.88 (м, 4H); 2.33-3.03 (м, 2H); 3.75 (с., 1H); 4.37 (с., 2H); 7.08-7.37 (м, 3H); 7.93 (с, 1H); 8.23 (с, 1H)
15	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂	CH	А-тип	131~132	0.70 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 1.16~2.65 (м, 5H); 2.53 (ш.с., 2H); 2.72 (с., 1H); 4.01 (с., 2H); 6.99 (с, 1H); 7.03 (ш.с., 1H); 7.24 (с, 1H); 7.58 (с., 1H)
16	CH ₃	H	4-Cl	N	А-тип	100~102	0.74 (д., 3H, J=6); 1.00~2.27 (м, 6H); 2.49 (д., 2H, J=6.4); 3.07 (с, 1H); 4.20 (с., 2H); 7.03 (д., 2H, J=8.4); 7.22 (д., 2H, J=8.4); 7.95 (с, 1H); 8.08 (с., 1H)
17	CH ₃	H	4-Cl	CH	А-тип	118~119	0.85 (д., 3H, J=5.8); 1.07~2.23 (м, 6H); 2.51 (ш.д., 2H, J=6.4); 3.34 (ш.с, 1H); 3.95 (с., 2H); 6.95 (с, 1H); 6.98 (д., 2H, J=8); 7.01 (с, 1H); 7.18 (д., 2H, J=8); 7.48 (с, 1H)
18	H	CH ₃	4-Cl	N	А-тип	75~76	0.99 (д, 3H, J=6.4); 1.28~2.24 (м, 6H); 2.28~2.58 (м, 2H); 3.60 (с, 1H); 3.99 (д, 1H, J=14), 4.39 (д, 1H, J=14); 6.97 (д, 2H, J=9); 8.00 (с, 1H); 8.18 (с, 1H); 7.24 (д, 2H, J=9)
19	H	CH ₃	4-Cl	N	В-тип	79~81	0.80 (д, 3H, J=6.4); 0.99-2.56 (м, 7H); 2.73~3.39 (м, 1H); 3.90 (ш.с, 1H); 4.11 (д., 1H, J=14); 4.38 (д, 1H, J=14); 7.04 (д, 2H, J=9.4); 7.26 (д., 2H, J=9.4); 7.92 (с, 1H); 8.22 (с, 1H)
20	CH ₃	H	4-Cl	N	В-тип	масло	0.88 (д., 3H, J=6.6); 1.05~2.45 (м, 7H); 2.62~2.92 (М, 1H); 3.85~4.25 (м.л., 1H, OH); 4.31 (с, 2H); 6.98 (д., 2H, J=8.8); 7.22 (м.л., 2H, J=8.8); 7.95 (с., 1H); 8.26 (с., 1H)
21	CH ₃	CH ₃	H	N	А-тип	масло	0.63 (с., 3H); 1.03 (с., 3H); 1.13~2.83 (м., 7H); 3.57 (с., 1H); 4.23 (с., 2H); 7.23 (с., 5H); 8.00 (с., 1H); 8.17 (с., 1H)
22	CH ₃	CH ₃	H	CH	А-тип	128-130	0.77 (с., 3H); 1.03 (с., 3H); 1.10~2.17 (м., 5H); 1.97 (с, 1H); 2.17-2.50 (м., 2H); 3.97 (с., 2H); 6.87-7.33 (м., 7H); 7.57 (с, 1H)

Соединение	Радикалы в формуле (1)				Тип стерео-изомера	Т. пл., °С	Спектр ЯМР (CDCl ₃ , млн. д.)
	R ¹	R ²	X _n	A			
23	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	N	А-тип	123~124	0.57 (с, 3H); 1.02 (с, 3H); 1.10~2.57 (м, 8H); 2.27 (с, 3H); 4.20 (с, 2H); 7.02 (с, 4H); 7.95 (с, 1H); 8.13 (с, 1H)
24	CH ₃	CH ₃	5-CH ₃	N	В-тип	114~115	0.73 (с, 3H); 0.98 (с, 3H); 1.07~3.00 (м, 7H); 2.25 (с, 3H); 3.72 (с, 1H); 4.28 (с, 2H); 6.93 (с, 4H); 7.83 (с, 1H); 8.10 (с, 1H)
25	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	CH	А-тип	132~133	0.75 (с, 3H); 1.02 (с, 3H); 1.02~2.42 (м, 8H); 2.27 (с, 3H); 3.93 (с, 2H); 3.93 (с, 2H); 6.98 (с, 4H); 7.02 (с, 2H); 7.58 (с, 1H)
26	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	CH	В-тип	130-131	0.83 (с, 3H); 1.07 (с, 3H); 1.17~3.07 (м, 8H); 2.27 (с, 3H); 4.07 (с, 2H); 6.77~7.20 (м, 2H); 6.95 (с, 4H); 7.62 (с, 1H)
27	CH ₃	CH ₃	2-F-4-Cl	N	А-тип	129-130	0.62 (с, 3H); 1.02 (с, 3H); 1.13~2.67 (м, 7H); 3.82 (с, 1H); 4.21 (с, 2H); 6.23~7.23 (м, 3H); 7.89 (с, 1H); 8.11 (с, 1H)
28	CH ₃	CH ₃	2-F-4-Cl	CH	А-тип	152-154	0.78 (с, 3H); 1.02 (с, 3H); 1.10~2.80 (м, 8H); 3.98 (с, 2H); 6.68~7.20 (м, 5H); 7.57 (м, 4H)
29	C ₂ H ₅	H	4-Cl	N	А-тип	82-84	0.67~2.23 (м, 11H); 2.34 (д, 2H, J=7); 2.93 (с, 1H); 4.20 (с, 2H); 6.93~7.33 (м, 4H); 7.93 (с, 1H); 8.07 (с, 1H)
30	H	C ₂ H ₅	4-Cl	N	А-тип	93-95	0.70~2.13 (м, 11H); 2.13~2.47 (м, 2H); 3.83 (с, 1H); 4.00 (д, 1H, J=14); 4.30 (д, 1H, J=14); 6.88 (д, 2H, J=8); 7.18 (д, 2H, J=8); 7.93 (с, 1H); 8.17 (с, 1H)
31	H	C ₂ H ₅	4-Cl	N	В-тип	76-78	0.67~3.33 (м, 13H); 3.07 (д, 1H, J=10); 4.13 (д, 1H, J=14); 4.40 (д, 1H, J=14); 7.03 (д, 2H, J=8); 7.23 (д, 2H, J=8); 7.97 (с, 1H); 8.18 (с, 1H)
32	C ₂ H ₅	H	4-Cl	N	В-тип	110-112	0.67~2.20 (м, 12H); 2.73 (д, 1H, J=10); 4.15 (с, 1H); 4.30 (с, 2H); 6.95 (д, 2H, J=8); 7.20 (д, 2H, J=8); 7.97 (с, 1H); 8.25 (с, 1H)
33	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	N	А-тип	124-126	0.67~1.07 (м, 6H); 1.07~2.40 (м, 11H); 3.52 (с, 1H); 4.30 (с, 2H); 6.87 (д, 2H, J=9); 7.18 (д, 2H, J=9); 7.93 (с, 1H); 8.18 (с, 1H)
34	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	N	В-тип	143-145	0.87 (т, 6H, J=6); 1.10~1.97 (м, 8H); 1.97~2.54 (м, 2H); 2.73 (д, 1H, J=9); 3.30-3.70 (ш.л, 1H); 4.43 (с, 2H); 6.92 (д, 2H, J=9); 7.20 (д, 2H, J=9); 7.97 (с, 1H); 8.27 (с, 1H)
35	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	CH	А-тип	масло	0.87 (т, 6H, J=6); 1.07-2.50 (м, 11H); 3.33 (с, 1H); 3.90 (д, 1H, J=14); 4.18 (д, 1H, J=14); 6.70-7.23 (м, 6H); 7.67 (с, 1H)
36	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	CH	В-тип	143-145	0.87 (т, 6H, J=6); 1.10-2.33 (м, 10H); 2.53~2.88 (м, 2H); 4.13 (с, 2H); 6.75~7.35 (м, CH); 7.70 (с, 1H)

Соединение	Радикалы в формуле (1)				Тип стерео-изомера	Т. пл., °C	Спектр ЯМР(CDCl ₃ млн. д.)
	R ¹	R ²	Xn	A			
37	n-C ₃ H ₇	H	4-Cl	N	А-тип	83-85	0.61~2.26 (м, 13H); 2.26~2.57 (м, 2H); 2.51~2.81 (ш.л., 1H); 4.21 (с, 2H); 7.03 (д, 2H, J=9); 7.23 (д, 2H, J=9); 7.96 (с, 1H); 8.07 (с, 1H)
38	H	n-C ₃ H ₇	4-Cl	N	А-тип	75-77	0.65~1.04 (м, 3H); 1.04~2.18 (м, 10H); 2.18~2.48 (м, 2H); 3.70 (ш.с., 1H); 3.98 (д, 1H, J=14); 4.29 (д, 1H, J=14); 6.86 (д, 2H, J=8.4); 7.16 (д, 2H, J=8.4); 7.94 (с, 1H); 8.12 (с, 1H)
39	n-C ₃ H ₇	H	4-Cl	CH	А-тип	115-117	0.57~1.04 (м, 3H); 1.04~2.24 (м, 10H); 2.43 (ш.с., 2H); 2.55 (ш.с., 1H); 3.96 (с, 2H); 6.99 (д., 2H, J=8.4); 7.02 (ш.с., 2H); 7.20 (д, 2H, J=8.4); 7.45 (ш.с., 1H)
40	C ₂ H ₅	H	2.4-Cl ₂	N	А-тип	124-127	0.63~2.40 (м, 11H); 2.68 (д, 2H, J=6); 3.10 (с, 1H); 4.23 (с, 2H); 7.13 (ш.с., 2H); 7.30 (ш.с., 1H); 7.93(с, 1H); 8.10 (с, 1H)
41	C ₂ H ₅	H	2.4-Cl ₂	CH	А-тип	111-113	0.67~2.27 (м, 11H); 2.50 (д, 2H, J=7); 2.63 (ш.с., 1H); 3.98 (с, 2H); 6.90 (ш.с., 2H); 6.97 (ш.с., 2H); 7.37 (ш.с, 1H); 7.50 (ш.с, 1H)
42	C ₂ H ₅	H	4-F	N	А-тип	73-74	0.62~2.19 (м, 11H); 2.30~2.51 (м, 2H); 2.62 (с, 1H); 4.15 (с, 2H); 6.64~7.23 (м, 4H); 7.83 (с, 1H); 7.99 (с, 1H)
43	C ₂ H ₅	H	4-F	CH	А-тип	111-113	0.66~2.07 (м, 11H); 2.19 (с, 1H); 2.35~2.60 (м, 2H); 3.93 (с, 2H); 6.63~7.20 (м, 6H); 7.41 (ш.с, 1H)
44	C ₂ H ₅	H	4-Br	N	А-тип	80-82	0.68~2.25 (м, 11H); 2.43 (д, 2H, J=7); 2.85 (с, 1H); 4.22 (с., 2H); 7.02 (д, 2H, J=8); 7.37 (д, 2H, J=7); 7.93 (с, 1H); 8.08 (с, 1H)
45	C ₂ H ₅	H	4-Br	CH	А-тип	117-119	0.60~2.50 (м, 11H); 2.33~3.02 (м, 2H); 3.18 (ш.с., 1H); 4.00 (с, 2H); 6.88~7.02 (м, 2H); 7.03~7.35 (м, 3H); 7.48 (ш.с., 1H)
46	C ₂ H ₅	H	4-C ₆ H ₅	N	А-тип	107-109	0.56~2.24 (м, 11H); 2.40~2.60 (м, 2H); 2.65 (с, 1H); 4.20 (с, 2H); 7.05~7.70 (м, 9H); 7.95 (с, 1H); 8.05 (с, 1H)
47	C ₂ H ₅	H	4-C ₆ H ₅	CH	А-тип	169-170	0.66~2.28 (м, 11H); 2.01 (с, 1H); 2.45~2.72 (м, 2H); 3.96 (с, 2H); 6.65~7.63 (м, 12H)
48	C ₂ H ₅	H	4.1-C ₄ H ₉	N	А-тип	масло	0.85 (т, 3H, J=7); 1.29 (с, 9H); 0.90~1.90 (м, 8H); 2.41 (дд, 1H, J=14.10); 2.49 (дд, 1H, J=14.5); 4.23 (с, 2H); 7.07 (д, 2H, J=8.3); 7.28 (д, 2H, J=8.3); 7.96 (с, 1H); 8.01 (с, 1H)
49	C ₂ H ₅	H	4.1-C ₄ H ₉	CH	А-тип	132-133	0.67~2.83 (м, 14H); 1.32 (с, 9H); 4.08 (с, 2H); 6.97~7.53 (м, 6H); 7.58 (с, 1H)
50	1-C ₃ H ₇	H	4-Cl	CH	А-тип	91-92	0.95 (д, 3H, J=7); 0.97 (д, 3H, J=7); 1.17~2.93 (м, 10H); 4.12 (д, 1H, J=14); 4.41 (д, 1H, J=14); 6.87~7.40 (м, 4H); 7.97 (с, 1H); 8.13 (с, 1H)

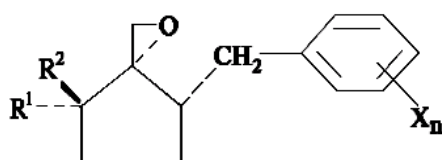
Соединение	Радикалы в формуле (1)				Тип стерео-изомера	Т. пл., °С	Спектр ЯРМ(CDCl ₃ млн. д.)
	R ¹	R ²	X _n	A			
51	n-C ₅ H ₁₁	H	4-Cl	N	А-тип	масло	0.86 (т, 3H, J=6.8); 0.90~1.98 (м, 14H); 2.38 (дд, 1H, J=13.4, 9.3); 2.46 (дд, 1H, J=13.4, 5.4); 2.57 (с, 1H); 4.23 (с, 2H); 7.06 (д, 2H, J=8.3); 7.22 (д, 2H, J=8.3); 7.97 (с, 1H); 8.08 (с, 1H)
52	n-C ₅ H ₁₁	H	4-Cl	N	А-тип	92-95	0.87 (т, 3H, J=6.8); 1.05~1.95 (м, 14H); 2.43 (дд, 1H, J=13.7, 10.3); 2.56 (дд, 1H, J=13.7, 4.4); 3.47 (с, 1H); 3.99 (с, 2H); 6.94 (с, 1H); 7.05 (д, 2H, J=8.3); 7.06 (с, 1H); 7.22 (д, 2H, J=8.3); 7.48 (с, 1H)
53	C ₂ H ₅	H	4-Cl	CH	В-тип	138~140	0.57-0.98 (м, 3H); 0.98~2.17 (м, 9H); 2.73 (д, 1H, J=10); 3.43 (ш.с., 1H); 4.03 (с, 2H); 6.83~7.03 (м, 6H); 7.68 (ш.м., 1H)
54	H	n-C ₅ H ₁₁	4-Cl	CH	А-тип	масло	(0.88 (т, 3H, J=6.8); 1.00~1.94 (м, 14H); 2.31 (м, 2H); 3.70 (ш.с., 1H); 4.05 (д, 1H, J=13.7); 4.26 (д, 1H, J=13.7); 6.89 (д, 2H, J=8.3); 7.17 (д, 2H, J=8.3); 7.99 (с, 1H); 8.15 (с, 1H)
55	CH ₃	CH ₃	4-C ₆ H ₅	N	А-тип	122-124	0.63 (с, 3H); 1.02 (с, 3H); 1.10 ~ 2.13 (м, 4H); 2.47 (ш.с., 3H); 3.62 (с, 1H); 3.23 (с, 2H); 7.10 ~ 7.73 (м, 9H); 7.97 (с, 1H); 8.17 (с, 1H)
56	CH ₃	CH ₃	4-C ₆ H ₅	N	В-тип	116-118	0.77 (с, 3H); 0.98 (с, 3H); 1.10~2.80 (м, 5H); 2.33 (д, 1H, J=9); 2.98 (д, 1H, J=9); 3.88 (с, 1H); 4.33 (с, 2H); 7.07~7.73 (м, 9H); 7.97 (с, 1H); 8.25 (с, 1H)
57	CH ₃	CH ₃	4-C ₆ H ₅	N	А-тип	162-163	0.80 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 1.12~2.08 (м, 4H); 2.137 (ш.с., 3H); 2.43 (с, 1H); 4.00 (с, 2H); 6.88~7.78 (м, 12H)
58	CH ₃	CH ₃	4-C ₆ H ₅	CH	В-тип	165-167	0.85 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 1.13~2.77 (м, 5H); 2.30 (д, 1H, J=9); 2.95 (д, 1H, J=9); 3.60 (с, 1H); 4.13 (с, 2H); 6.90~7.87 (м, 12H)
59	1-C ₃ H ₇	H	4-Cl	CH	А-тип	масло	0.97 (д, 3H, J=7); 1.00 (д, 3H, J=7); 1.23~2.53 (м, 10H); 3.90 (д, 1H, J=14); 4.17 (д, 1H, J=14); 6.90~7.43 (м, 6H); 7.53 (ш.с., 1H)
60	CH ₃	CH ₃	4-Т-C ₄ H ₉	CH	А-тип	107-108	0.62 (с, 3H); 1.01 (с, 3H); 1.27 (с, 9H); 1.17~2.00 (м, 5H); 2.17~2.67 (м, 2H); 3.50 (с, 1H); 4.22 (с, 2H); 7.00 (д, 2H, J=8.4); 7.25 (д, 2H, J=8.4); 7.92 (с, 1H); 8.12 (с, 1H)
61	CH ₃	CH ₃	4-Т-C ₄ H ₉	N	А-тип	167-168	0.78 (с, 1H); 1.02 (с, 3H); 1.29 (с, 9H); 1.14~2.10 (м, 5H); 2.14~2.57 (м, 2H); 2.40 (с, 1H); 3.97 (с, 2H); 6.96 (д, 2H, J=8.4); 7.03 (ш.с., 2H); 7.23 (д, 2H, J=8.4); 7.59 (ш.с., 1H)

Соединение	Радикалы формул (I)				Тип стерео-изомера	Т. пл., °С	Спектр ЯМР (СВCl ₃ млн. д.)
	R ¹	R ²	X _n	A			
62	H	1-C ₃ H ₇	4-Cl	CH	В-тип	масло	0.60~3.17 (м, 15H); 3.43 (ш.с., 1H); 4.20 (с, 2H); 6.92 (д, 2H, J=8); 7.15 (д, 2H, J=8); 7.87 (с, 1H); 8.07 (с, 1H)
63	H	1-C ₃ H ₇	4-Cl	N	А-тип	102~103	0.70~2.33 (м, 15H); 3.47 (ш.с., 1H); 3.97 (д, 1H, J=14); 4.38 (д, 1H, J=14); 6.73 (д, 2H, J=8); 7.10 (д, 2H, J=8); 7.93 (с, 1H); 8.10 (с, 1H)
64	H	1-C ₃ H ₇	4-Cl	CH	А-тип	146-147	0.83~2.43 (м, 16H); 3.73 (д, 1H, J=14); 4.22 (д, 1H, J=14); 6.60~7.27 (м, 6H); 7.63 (с, 1H)
65	1-C ₃ H ₇	H	4-Cl	N	В-тип	120~121	0.70~2.63 (м, 15H); 3.70 (ш.с., 1H); 4.33 (с, 2H); 7.00 (д, 2H, J=8); 7.27 (д, 2H, J=8); 8.07 (с, 1H); 8.40 (с, 1H)
66	n-C ₄ H ₉	H	4-Cl	CH	А-тип	масло	0.57~2.67 (м, 17H); 3.05 (с, 1H); 3.95 (с, 2H); 6.68-7.25 (м, 6H); 7.38 (ш.с., 1H)
67	H	n-C ₄ H ₉	4-Cl	N	А-тип	94~95	0.63~2.43 (м, 17H); 3.67 (с, 1H); 3.95 (д, 1H, J=14); 4.25 (д, 1H, J=14); 6.77 (д, 2H, J=8); 7.07 (д, 2H, J=8); 7.88 (с, 1H); 8.02 (с, 1H)
68	H	n-C ₄ H ₉	4-Cl	N	В-тип	масло	0.60~2.33 (м, 16H); 2.90~3.20 (м, 1H); 3.30 (с, 1H); 4.22 (с, 2H); 6.88 (д, 2H, J=8); 7.12 (д, 2H, J=8); 7.83 (с, 1H); 8.02 (с, 1H)
69	1-C ₄ H ₉	H	4-Cl	N	А-тип	масло	0.78 (д, 3H, J=6); 0.88 (д, 3H, J=6); 1.07~2.27 (м, 9H); 2.33~2.67 (м, 3H); 4.22 (с, 2H); 7.00 (д, 2H, J=9); 7.2 (д, 2H, J=9); 7.93 (с, 1H); 8.05 (с, 1H)
70	1-C ₄ H ₉	H	4-Cl	CH	А-тип	масло	0.81 (д, 3H, J=6); 0.88 (д, 3H, J=6); 1.03~2.10 (м, 9H); 2.26~2.70 (м, 2H); 3.88 (с, 1H); 4.00 (с, 2H); 6.70~7.30 (м, 6H); 7.46 (с, 1H)
71	n-C ₄ H ₉	HR ¹	4-Cl R ²	N X _n	А-тип А	масло	0.60~2.63 (м, 17H); 2.80 (с, 1H); 4.23 (с, 2H); 7.07 (д, 2H, J=8); 7.27 (д, 2H, J=8); 8.00 (с, 1H); 8.13(с, 1H)
72	Изомер а	CH ₃	C ₂ H ₅	N 4-Cl	А-тип	Смесь 72-а 72-	0.57~1.02 (м, 6H); 1.12~2.55 (м, 9H); 3.55~3.67 (2с, 1H); 4.20 (ш.с., 2H)
	Изомер б C ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl	N	А-тип	98-101	6.95 (д, 2H, J=9); 7.18 (д, 2H, J=9); 7.92 (с, 1H); 8.12(с, 1H)
73	Изомер а CH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl	N	В-тип	Смесь 73-а 73-	0.67~1.05 (м, 6H); 1.05~3.12 (м, 9H); 3.77, 3.92 (2с, 1H); 4.35 (с, 2H)
	Изомер б C ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl	N		117-119	6.95 (д, 2H, J=8); 7.18 (д, 2H, J=8); 7.90 (с, 1H); 8.15, 8.15 (2с, 1H)

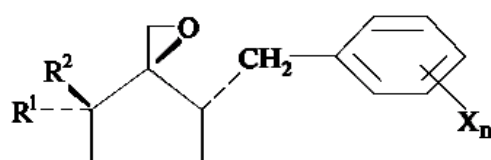
Продолжение табл. 1

Соединение	Радикалы в формуле (1)				Тип стерео-изомера	Т. пл., °C	Спектр ЯМР (CDCl ₃ , млн. д.)
	R ¹	R ²	X _n	A			
74	Изомер а CH ₃	C ₂ H ₅ CH ₃	4-Cl	CH	В-тип	Смесь 74-а 74-	0.63~1.08 (м, 6H); 1.08~3.07(м, 9H); 3.33 (с, 1H); 4.12(ш.с., 2H)
	Изомер б C ₂ H ₅		4-Cl	CH	В-тип	122-127	6.80~7.30 (м, 6H); 7.70 (ш.с., 1H)
75	CH ₃	CH ₃	4-т- C ₄ H ₉	N	В-тип	Масло	0.77 (с, 3H); 1.01 (с, 3H); 1.28 (с, 9H); 1.39~2.11 (м, 5H); 2.12-2.54 (с, 2H); 3.78 (б.с., 1H); 4.31 (с, 2H); 6.95 (д, 2H, J=8.4); 7.20 (д, 2H, J=8.4); 7.88 (с, 1H); 8.14 (с, 1H) 0.84 (с, 3H); 1.06 (с, 3H); 1.30
76	CH ₃	CH ₃	4-т- C ₄ H ₉	CH	В-тип	132-133	(с, 9H); 1.43~3.10 (м, 8H); 4.13 (с, 2H); 6.87 (ш.с., 1H); 7.01 (д, 2H, J=8.4); 7.19 (ш.с., 1H); 7.29 (д, 2H, J=8.4); 7.73 (ш.с., 1H)

Таблица 2



(II - A)



(II - B)

Соединение	Радикалы в формуле (I)			Тип стерео-изомера	Физические свойства	Спектр ЯМР (CDCl ₃ , млн. д.)
	R ¹	R ²	X _n			
77	CH ₃	CH ₃	4-Cl	А-тип	Масло	0.83 (с, 3H); 0.95 (с, 3H); 1.33~1.73 (м, 4H); 2.33~2.53 (м, 3H); 2.52 (д, 1H, J=4); 2.67 (д, 1H, J=4), 7.03 (д, 2H, J=8); 7.23 (д, 2H, J=8)
78	CH ₃	CH ₃	4-Cl	В-тип	Тоже	0.87 (с, 3H); 0.98 (с, 3H); 1.45~1.73 (м, 4H); 2.13~2.70 (м, 3H); 2.60 (д, 1H, J=4); 2.83 (д, 1H, J=4), 7.02 (д, 2H, J=8); 7.23 (д, 2H, J=8)
79	CH ₃	CH ₃	4-Br	А-тип		0.83 (с, 3H); 0.93 (с, 3H); 1.17~1.73 (м, 4H); 2.17~2.67 (м, 3H); 2.50 (д, 1H, J=4); 2.60 (с, 1H, J=4), 6.80~7.33 (м, 4H)

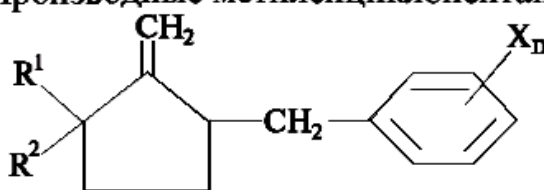
Соединение	Радикалы в формуле (I)			Тип стереоизомера	Физические свойства	Спектр ЯМР (CDCl ₃ , млн. д.)
	R ¹	R ²	Xn			
80	CH ₃	CH ₃	4-Br	В-тип	- " -	0.87 (с, 3H); 0.93 (с, 3H); 1.20~2.73 (м, 1H); 2.60 (д, 1H, J=4); 2.80 (д, 1H, J=4); 6.80-7.47 (м, 4H)
81	CH ₃	CH ₃	4-F	А-тип	- " -	0.80 (с, 3H); 0.90 (с, 1H); 1.00~2.00 (м, 4H); 2.00~2.67 (м, 5H); 6.70~7.23 (м, 4H)
82	CH ₃	CH ₃	4-F	В-тип	- " -	0.88 (с, 3H); 0.93 (с, 3H); 1.03~2.00 (м, 4H); 2.00~2.93 (м, 5H); 6.70~7.27 (м, 4H)
83	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂	А-тип	- " -	0.85 (с, 3H); 0.92 (с, 3H); 1.27~1.82 (м, 4H); 2.28~2.78 (м, 5H); 6.92~7.28 (м, 3H)
84	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂	В-тип	- " -	0.87 (с, 3H); 0.97 (с, 3H); 1.48~1.72 (м, 4H); 2.33~2.77 (м, 3H); 2.62 (д, 1H, J=4); 2.85 (д, 1H, J=4); 7.05~7.37 (м, 3H)
85	CH ₃	H	4-Cl	А-тип	- " -	0.80 (д, 3H, J=6); 1.14~2.51 (м, 6H); 2.31~2.51 (ш.л., 2H); 2.63 (с, 2H); 7.00 (д, 2H, J=9); 7.19 (д, 2H, J=9)
86	H	CH ₃	4-Cl	А-тип	- " -	0.89 (д, 3H, J=6); 0.85~2.68 (м, 6H); 2.32~2.42 (ш.л., 2H); 2.47 (д, 1H, J=4.6); 2.78 (д, 1H, J=4.6); 6.75~7.28 (м, 4H)
87	H	CH ₃	4-Cl	В-тип	- " -	0.81 (д, 3H, J=6); 0.93~3.00 (м, 8H); 2.54 (д, 1H, J=4.6); 2.79 (д, 1H, J=4.6); 6.80-7.33 (м, 4H)
88	CH ₃	H	4-Cl	В-тип	- " -	1.09 (д, 3H, J=6); 0.83~3.26 (м, 10H); 6.95 (д, 2H, J=9); 7.14 (д, 2H, J=9)
89	CH ₃	CH ₃	H	А-тип	- " -	0.73~2.07 (м, 5H); 0.87 (с, 3H); 0.97 (с, 3H); 2.27~2.77 (м, 2H); 2.55 (д, 1H, J=4); 2.67 (д, 1H, J=4); 7.23 (с, 5H)
90	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	А-тип	- " -	0.83 (с, 3H); 0.97 (с, 3H); 1.17~1.97 (м, 5H); 2.17~2.77 (м, 2H); 2.27 (с, 3H); 2.55 (д, 1H, J=4); 2.65 (д, 1H, J=4); 7.00 (с, 4H)
91	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	В-тип	- " -	0.87 (с, 3H); 0.93 (с, 3H); 1.47~1.77 (м, 5H); 2.17~2.97 (м, 2H); 2.30 (с, 3H); 2.65 (д, 1H, J=4); 2.87 (д, 1H, J=4); 7.07 (с, 4H)
92	CH ₃	CH ₃	2-F-4-Cl	А-тип	- " -	0.83 (с, 3H); 0.93 (с, 3H); 1.09~2.79 (м, 9H); 6.83~7.15 (м, 3H)
93	C ₂ H ₅	H	4-Cl	А-тип	- " -	0.60~2.83 (м, 11H); 2.43 (ш.с., 2H); 2.65 (с, 2H); 6.92~7.33 (м, 4H)
94	H	C ₂ H ₅	4-Cl	А-тип	- " -	0.67~2.77 (м, 11H); 2.37 (ш.с., 2H); 2.53 (д, 1H, J=4); 2.85 (д, 1H, J=4); 6.87~7.33 (м, 4H)

Соединение	Радикалы в формуле (I)			Тип стерео-Изомера	Физические свойства	Спектр ЯМР (CDCl ₃ , млн. д.)
	R ¹	R ²	X _n			
95	H	C ₂ H ₅	4-Cl	В-тип	-"	0.60~2.92 (м, 13H); 2.51 (д, 1H, J=4); 2.82 (д, 1H, J=4), 6.87~7.30 (м, 4H)
96	C ₂ H ₅	H	4-Cl	В-тип	-"	0.67~2.85 (м, 13H); 2.75 (с, 2H); 6.88 ~ 7.33 (м, 4H)
97	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	А-тип	-"	0.57~1.03 (м, 6H); 1.03~2.05 (м, 9H); 2.38 (ш.с., 2H), 2.57 (д, 1H, J=4); 2.67 (д, 1H, J=4); 6.90~7.30 (м, 4H)
98	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	В-тип	-"	0.63~1.03 (м, 6H); 1.03~1.90 (м, 9H); 2.07~2.50 (м, 2H), 2.62 (д, 1H, J=4); 2.75 (д, 1H, J=4); 6.83~7.23 (м, 4H)
99	-C ₂ H ₇	H	4-Cl	А-тип	-"	0.59~1.02 (м, 3H); 1.02~2.29 (м, 10H); 2.29~2.52 (м, 2H), 2.68 (с, 2H); 7.05 (д, 2H, J=9); 7.25 (д, 2H, J=9)
100	H	-C ₃ H ₇	4-Cl	А-тип	-"	0.62~1.03 (м, 3H); 1.03~2.32 (м, 10H); 2.32~2.48 (ш.л., 2H), 2.53 (д, 1H, J=4.4); 2.86 (д, 1H, J=4.4); 7.03 (д, 2H, J=9); 7.22 (д, 2H, J=9)
101	C ₂ H ₅	H	2,4-Cl ₂	А-тип	-"	0.67~3.10 (м, 13H); 2.70 (с, 2H); 7.10 (м, 2H), 7.28 (м, 1H)
102	C ₂ H ₅	H	4-F	А-тип	-"	0.65~2.50 (м, 13H); 2.62 (с, 2H); 6.60 ~ 7.24 (м, 4H)
103	C ₂ H ₅	H	4-Br	А-тип	-"	0.67~2.13 (м, 11H); 2.42 (м, 2H); 2.65 (с, 2H); 6.98 (д, 2H, J=8); 7.35 (д, 2H, J=8)
104	C ₂ H ₅	H	4-C ₆ H ₅	А-тип	Тв. в-во, т.пл. 69-71°C	0.63~2.58 (м, 13H); 2.66 (с, 2H); 7.04~7.68 (м, 9H)
105	C ₂ H ₅	H	4-т-C ₄ H ₉	А-тип	Масло	0.69~2.55 (м, 13H); 1.27 (с, 9H); 2.65 (с, 2H); 6.93~7.42 (м, 4H)
106	1-C ₃ H ₇	H	4-Cl	А-тип	Тоже	0.85 (д, 6H, J=7); 1.00~2.83 (м, 9H); 2.63 (с, 2H); 6.90~7.33 (м, 4H)
107	n-C ₅ H ₁₁	H	4-Cl	А-тип	-"	0.87 (т, 3H, J=6.8); 1.00 ~ 2.56 (м, 16H); 2.67 (д, 1H, J=4.4); 2.71 (д, 1H, J=4.4); 7.08 (д, 2H, J=8.3); 7.22 (д, 2H, J=8.3)
108	H	n-C ₅ H ₁₁	4-Cl	А-тип	-"	0.87 (т, 3H, J=6.8); 1.00~2.54 (м, 16H); 2.56 (д, 1H, J=4.4); 2.88 (д, 1H, J=4.4); 7.09 (д, 2H, J=8.3); 7.23 (д, 1H, J=8.3)
109	CH ₃	CH ₃	4-т-C ₄ H ₉	А-тип	-"	0.80 (с, 3H); 0.94 (с, 3H); 1.28 (с, 9H); 1.41~1.96 (м, 4H); 2.18~2.48 (ш.л., 3H); 2.55 (д, 1H, J=4.4); 2.64 (д, 1H, J=4.4); 7.02 (д, 2H, J=8); 7.18 (д, 2H, J=8)

Продолжение таблицы 2

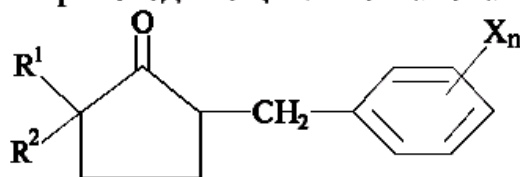
Соединение	Радикалы в формуле (I)			Тип стерео-изомера	Физические свойства	Спектр ЯМР (CDCl ₃ , млн. д.)
	R ¹	R ²	X _n			
110	CH ₃	CH ₃	4-т-C ₄ H ₉	В-тип	-"	0.87 (с, 3H); 0.94 (с, 3H); 1.28 (с, 9H); 1.40~1.93 (м, 4H); 2.20~2.76 (м, 3H); 2.60 (д, 1H, J=4.4); 2.84 (д, 1H, J=4.4); 7.02 (д, 2H, J=8); 7.27 (д, 2H, J=8)
111	CH ₃	CH ₃	4-C ₆ H ₅	А-тип	-"	0.83 (с, 3H); 0.92 (с, 3H); 1.10~2.18 (м, 4H); 2.47 (ш.с., 3H); 2.50 (д, 1H, J=4); 2.63 (д, 1H, J=4); 6.97~7.63 (м, 9H)
112	CH ₃	CH ₃	4-C ₆ H ₅	В-тип	-"	0.85 (с, 3H); 0.93 (с, 3H); 1.20~1.97 (м, 4H); 1.97~2.90 (м, 3H); 2.57 (д, 1H, J=4); 2.82 (д, 1H, J=4); 6.97~7.58 (м, 9H)
113	H	-C ₃ H ₇	4-Cl	А-тип	-"	0.82 (д, 3H, J=6); 0.85 (д, 3H, J=6); 0.97~2.73 (м, 9H); 2.60 (д, 1H, J=4); 2.88 (д, 1H, J=4); 6.93~7.37 (м, 4H)
114	H	-C ₃ H ₇	4-Cl	В-тип	-"	0.67~1.03 (м, 6H); 1.03~2.77 (м, 9H); 2.50 (д, 1H, J=4); 2.83 (д, 1H, J=4); 6.90~7.33 (м, 4H)
115	1-C ₃ H ₇	H	4-Cl	В-тип	-"	0.87 (д, 3H, J=6); 0.90 (д, 3H, J=6); 1.10~3.20 (м, 9H); 2.87 (с, 2H); 6.90~7.40 (м, 4H)
116	n-C ₄ H ₉	H	4-Cl	А-тип	-"	0.63~2.80 (м, 17H); 2.67 (с, 2H); 6.93~7.37 (м, 4H)
117	H	-C ₄ H ₉	4-Cl	А-тип	-"	0.50~2.70 (м, 17H); 2.50 (д, 1H, J=4); 2.83 (д, 1H, J=4); 6.90~7.30 (м, 4H)
118	H	-C ₄ H ₉	4-Cl	В-тип	-"	0.63~2.73 (м, 17H); 2.53 (д, 1H, J=4); 2.77 (д, 1H, J=4); 6.80~7.23 (м, 4H)
119	1-C ₄ H ₉	H	4-Cl	А-тип	-"	0.78 (д, 3H, J=7); 0.88 (д, 3H, J=7); 1.00~2.27 (м, 9H); 2.27~2.50 (м, 2H); 2.63 (с, 2H); 6.87~7.33 (м, 4H)
120	Изомер А	C ₂ H ₅	4-Cl	А-тип	Смесь	0.68~0.97 (м, 6H); 0.97~1.85 (м, 6H); 2.15~2.75 (м, 5H); 7.00 (д, 2H, J=8); 7.17 (д, 2H, J=8)
	CH ₃ "- В- C ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl	А-тип	120 а 120 Масло	
121	Изомер а	C ₂ H ₅	4-Cl	В-тип	Смесь	0.67~1.00 (м, 6H); 1.00~1.90 (м, 6H); 2.13~2.90 (м, 5H); 6.97 (д, 2H, J=8); 7.17(д, 2H, J=8)
	CH ₃ "- b C ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl	В-тип	121 а 121 Масло	

Производные метиленициклопентана



Соединение	Радикалы в формуле (III)			Физические свойства	Спектр ЯРМ (CDCl ₃ , млн. д.)
	R ¹	R ²	X _n		
122	CH ₃	CH ₃	4-Cl	Масло	1.03 (с, 3H); 1.08 (с, 3H); 1.28~1.85 (м, 4H); 2.25~3.12 (м, 3H); 4.75~4.95 (м, 2H); 7.07 (д, 2H, J=8); 7.27 (д, 2H, J=8)
123	CH ₃	CH ₃	4-Cl	Тоже	1.00 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 1.13~1.77 (м, 5H); 2.30~3.10 (м, 2H); 4.63~4.80 (м, 2H); 6.83~7.40 (м, 4H)
124	CH ₃	CH ₃	4-F	"-	1.00 (с, 3H); 1.07 (с, 3H); 1.13~2.00 (м, 4H); 2.00~3.13 (м, 3H); 4.72~4.90 (м, 2H); 6.70~7.28 (м, 4H)
125	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂	"-	1.07 (с, 3Hx2); 1.27~1.80 (м, 4H); 2.43~3.18 (м, 3H); 4.27~4.88 (м, 2H); 7.05~7.37 (м, 3H)
126	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	"-	1.03 (с, 3H); 1.07 (с, 3H); 0.66-1.90 (м, 5H); 2.17~3.13 (м, 2H); 4.83 (ш.с., 2H); 7.07 (с, 4H)
127	CH ₃	CH ₃	4-Т-С ₄ H ₉	"-	1.03 (с, 3H); 1.08 (с, 3H); 1.30 (с, 9H); 1.36~1.86 (м, 4H); 2.20~3.13 (м, 3H); 4.76~4.93 (ш.с., 2H); 7.07 (д, 2H, J=8); 7.27 (д, 2H, J=8)
128	CH ₃	CH ₃	4-С ₆ H ₅	"-	1.03 (с, 3H); 1.10 (с, 3H); 1.10~1.92 (м, 4H); 2.17-3.17 (м, 3H); 4.83 (ш.с., 2H); 7.08~7.70 (м, 9H)
129	C ₂ H ₅	H	4-Cl	"-	0.93 (т, 3H, J=7); 1.08-3.08 (м, 10H); 4.76~4.93 (м, 2H); 6.97~7.37 (м, 4H)
130	1-С ₃ H ₇	H	4-Cl	"-	0.60 (д, 3H, J=8); 0.70 (д, 3H, J=8); 0.87~2.97 (м, 9H); 4.57~4.83 (м, 2H); 6.77~7.20 (м, 4H)
131	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	"-	0.63-1.05 (м, 6H); 1.05~1.93 (м, 8H); 2.13~3.13 (м, 3H); 4.80 (дд, 2H, J=12.2); 6.95-7.33 (м, 4H)
132	CH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl	"-	0.63~1.10 (м, 6H); 1.10~1.80 (м, 6H); 2.23~3.13 (м, 3H); 4.67~4.87 (м, 2H); 7.03 (д, 2H, J=9); 7.23 (д, 2H, J=9)

Производные цикlopентанона



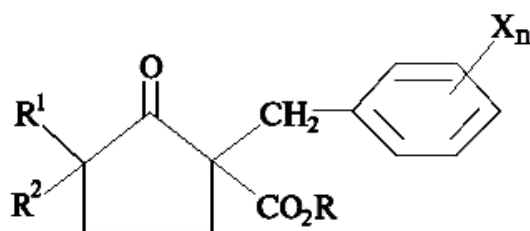
Соединение	Радикалы в формуле (IV)			Физические свойства	Спектр ЯРМ (CDCl ₃ , J м. д.)
	R ¹	R ²	X _n		
133	CH ₃	CH ₃	4-Cl	Т.кип.124°C 1ммHg Масло	3.83 (с, 3H); 1.05 (с, 3H); 1.52~1.83 (м, 4H); 2.25~3.17 (м, 3H); 6.97 (д, 2H, J=8); 7.17 (д, 2H, J=8)
134	CH ₃	CH ₃	4-Br	Т.кип.ВР 131~2°C (0.7мм Hg) Масло	0.87 (с, 3H); 1.07 (с, 3H); 1.17~3.27 (м, 7H); 6.83~7.53 (м, 4H)
135	CH ₃	CH ₃	4-F	Т. кип. 95-8°C (0.7 мм Hg) Масло	0.85 (с, 3H); 1.07 (с, 3H); 1.20~3.23 (м, 7H); 6.73~7.27 (м, 4H)
136	CH ₃	CH ₃	2.4-Cl ₂	Т. кип. 142- 6°C (1.5ммHg) Масло	0.90 (с, 3H); 1.05 (с, 3H); 1.3~2.07 (м, 4H); 2.23~3.40 (м, 3H); 7.0~7.32 (м, 3H)
137	CH ₃	H	4-Cl	Т. кип. 120- 135°C (3 мм Hg) Масло	0.97~1.08 (2д, 3H, J=7, J=6); 1.20~3.27 (м, 8H); 7.03 (д, 2H, J=7); 7.19 (д, 2H, J=7)
138	CH ₃	CH ₃	H	Т. кип. 93-94°C (0.3 мм Hg) Масло	0.87 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 0.83~3.23 (м, 7H); 7.07 (с, 5H)
139	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	Масло	0.87 (с, 3H); 1.07 (с, 3H); 1.20~3.20 (м, 7H); 2.27 (с, 3H); 7.70 (с, 4H)
140	CH ₃	CH ₃	2.4-4-Cl	Т. кип. 102 - 104°C (0.3 мм Hg) Масло	0.89 (с, 3H); 1.05 (с, 3H); 1.32~3.49 (м, 7H); 6.83~7.21 (м, 3H)
141	CH ₃	CH ₃	4-т-С ₄ H ₉	Т. кип. 132~140°C (1.0 мм Hg) Масло	0.86 (с, 3H); 1.04 (с, 3H); 1.26 (с, 9H); 1.37~3.21 (м, 7H); 6.95 (д, 2H, J=8.4); 8.18 (д, 2H, J=8.4)
142	CH ₃	CH ₃	4-С ₆ H ₅	Т. в-во МР 63-6°C	0.87 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 1.17~3.40 (м, 7H); 7.00~7.67 (м, 9H)

Продолжение таблицы 4

Соединение	Радикалы в формуле (IV)			Физические свойства	Спектр ЯРМ (CDCl ₃ , J м. д.)
	R ¹ C ₂ H ₅	R ² H	X _n 4-Cl		
143				Масло 135~145°C (0.65 мм Hg)	0.89 (т, 3H, J=7); 1.10-3.28 (м, 10H); 7.05 (д, 2H, J=9); 7.27 (д, 2H, J=9)
144	C ₂ H ₅	H	4-F	Масло Т. кип. 102~108°C (0.2 мм Hg)	0.70~1.10 (м, 3H); 1.10~3.28 (м, 10H); 6.70~7.26 (м, 4H)
145	C ₂ H ₅	H	4-Br	Масло Т. кип. 126~128°C (0.5 мм Hg)	0.87 (т, 3H, J=7); 1.10-3.40 (м, 10H); 6.97 (д, 2H, J=8); 7.32 (д, 2H, J=8)
146	C ₂ H ₅	H	2.4-Cl ₂	Масло Т. кип. 178~179°C (4 мм Hg)	0.90 (т, 3H, J=7); 1.10~3.60 (м, 10H); 7.17~7.30 (м, 3H)
147	C ₂ H ₅	H	4-т-C ₄ H ₉	Масло ВР 132°C (0.5 мм Hg)	0.87 (т, 3H, J=7); 1.00~3.30 (м, 10H); 6.87~7.43 (м, 4H)
148	C ₂ H ₅	H	4-C ₆ H ₅	Т. в-во МР 72~75°C	0.70~1.07 (м, 3H); 1.13~3.30 (м, 10H); 6.98~7.65 (м, 9H)
149	n-C ₃ H ₇	H	4-Cl	Масло ВР 150~160°C (3 мм Hg)	0.66~1.08 (м, 3H); 1.08~3.26 (м, 12H); 7.04 (д, 2H, J=9); 7.24 (д, 2H, J=9)
150	n-C ₃ H ₇	H	4-Cl	Масло ВР 143~149°C (1.2мм Hg)	0.60~1.07 (м, 6H); 1.07~3.27 (м, 9H); 6.83~7.27 (м, 4H)
151	n-C ₄ H ₉	H	4-Cl	Масло ВР 146-149°C (0.6 мм Hg)	0.87 (т, 3H, J=7); 1.03~3.28 (м, 14H); 7.02 (д, 2H, J=9); 7.25 (д, 2H, J=9.0)
152	n-C ₅ H ₁₁	H	4-Cl	Масло ВР 135-137°C (0.06 мм Hg)	0.87 (т, 3H, J=7.0); 1.10~2.50 (м, 14H); 2.53~3.10 (м, 2H); 7.08 (д, 2H, J=8.3); 7.24 (д, 2H, J=8.3)
153	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	Масло	0.57~1.07 (м, 6H); 1.07~3.27 (м, 11H); 6.95~7.37 (м, 4H)
154	1-C ₄ H ₉	H	4-Cl	Масло ВР 130-136°C (0.3 мм Hg)	0.85 (д, 3H, J=6); 0.90 (д, 3H, J=6); 1.10 ~ 3.33 (м, 11H); 7.00 (д, 2H, J=9); 7.21 (д, 2H, J=9)
155	CH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl	Масло ВР 123-130°C (0.2 мм Hg)	0.57~1.07 (м, 6H); 1.17~3.23 (м, 9H); 7.00 (д, 2H, J=9); 7.20 (д, 2H, J=9)

Производные сложного эфира циклопентанкарбоновой кислоты

Таблица 5



Соединение	Радикалы в формуле (V)				Физические свойства	Спектр ЯРМ (CDCl ₃ , J м. д.)
	R ¹	R ²	X _n	R		
156	CH ₃	CH ₃	4-Cl	CH ₃	Масло ВР 142-143°C (0.7 мм Hg)	0.72 (с, 3H); 1.05 (с, 3H); 1.37~2.40 (м, 4H); 3.13 (с, 2H); 3.70 (с, 3H); 7.07 (д, 2H, J=9); 7.27 (д, 2H, J=9)
157	CH ₃	CH ₃	4-Br	CH ₃	Масло	0.70 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 1.25~2.43 (м, 4H); 3.07 (с, 2H); 3.63 (с, 3H); 6.80~7.53 (м, 4H)
158	CH ₃	CH ₃	4-F	CH ₃	Масло	0.70 (с, 3H); 1.08 (с, 3H); 1.20~2.57 (м, 4H); 3.13 (с, 2H); 3.67 (с, 3H); 6.73~7.37 (м, 4H)
159	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂	CH ₃	Масло ВР 130-133°C 9(0.60 мм Hg)	0.70 (с, 3H); 16.05 (с, 3H); 1.20~2.45 (м, 4H); 3.10 (с, 2H); 3.65 (с, 3H); 7.05~7.30 (м, 3H)
160	CH ₃	H	4-Cl	CH ₃	Масло ВР 142-145°C (0.1 мм Hg)	0.83~1.12 (м, 3H); 1.40~2.63 (м, 5H); 3.12~3.15 (2с, 2H); 3.70 (с, 3H); 7.07 (д, 2H, J=8); 7.27 (д, 2H, J=8)
161	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	Масло	0.67 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 0.77~3.23 (м, 4H); 3.10 (с, 2H); 3.63 (с, 3H); 7.07 (с, 5H)
162	CH ₃	CH ₃	4-CH	CH ₃	То же	0.70 (с, 3H); 1.03 (с, 3H); 1.13~2.40 (м, 4H); 2.27 (с, 3H); 3.07 (с, 2H); 3.67 (с, 3H); 6.97 (с, 4H)
163	CH ₃	CH ₃	2-F-4-Cl	CH ₃	-"-	0.79 (с, 3H); 1.07 (с, 3H); 1.18~2.61 (м, 4H); 3.00 (д, 1H, J=14); 3.33 (д, 1H, J=14); 3.70 (с, 3H); 6.89~7.32 (м, 3H)
164	CH ₃	CH ₃	4-т-C ₄ H ₉	CH ₃	-"-	0.68 (с, 3H); 1.05 (с, 3H); 1.26 (с, 9H); 1.32~2.62 (с, 4H); 3.10 (ш.с., 2H); 3.68 (с, 3H); 7.01 (д, 2H, J=8.6); 7.26 (д, 2H, J=8.6)

Продолжение таблицы 5

Соединение	Радикалы в формуле (V)				Физические свойства	Спектр ЯРМ (CDCl ₃ , J м. д.)
	R ¹	R ²	Xn	R		
165	CH ₃	CH ₃	4-C ₆ H ₅	CH ₃	Т. пл. 95-98°C Тв. в-во	0.75 (с, 3H); 1.05 (с, 3H); 1.13-2.88 (м, 4H); 3.13 (с, 2H); 3.62 (с, 3H); 6.95~7.62 (м, 9H)
166	C ₂ H ₅	H	4-Cl	C ₂ H ₅	Масло ВР 152-160°C (0.45 мм Hg)	0.67-1.03 (м, 3H); 1.20 (т, 3H, J=7); 1.45~2.53 (м, 9H) 3.03~3.08 (2с, 2H); 4.10 (кв. 2H, J=7); 6.98 (д, 2H, J=9)
167	C ₂ H ₅	H	4-F	CH ₃	Масло ВР 144~154°C (3.0 мм Hg)	0.63~1.10 (м, 3H); 1.21~2.68 (м, 7H); 3.07~3.11 (2с, 2H); 3.66 (с, 3H); 6.70~7.22 (м, 4H)
168	C ₂ H ₅	H	4-Br	CH ₃	Масло ВР 149~151°C (0.5 мм Hg)	0.60~2.90 (м, 10H); 3.07~3.12 (2с, 2H); 3.67 (с, 3H); 7.06 (д, 2H, J=8.0); 7.42 (д, 2H, J=8.0)
169	C ₂ H ₅	H	2,4-Cl ₂	CH ₃	Масло ВР 143°C (0.5 мм Hg)	0.67~2.82 (м, 10H); 3.10 (д, 0.4H, J=14); 3.15 (д, 0.6H, J=16); 3.45 (д, 0.4H, J=14); 3.50 (д, 0.6H, J=14); 3.68 (с, 3H); 7.08 (м, 2H); 7.30 (м, 1H)
170	C ₂ H ₅	H	4-т-C ₄ H ₉	CH ₃	Масло ВР 152~156°C (0.2 мм Hg)	0.72~2.52 (м, 10H); 1.27 (с, 9H); 3.09 (ш.с., 2H); 3.65 (с, 3H); 6.79~7.39 (м, 4H)
171	C ₂ H ₅	H	4-C ₆ H ₅	CH ₃	Тв. в-во Т. пл. 52-54°C	0.61~1.10 (м, 3H); 1.45~2.50 (м, 7H); 3.11~3.16 (2с, 2H); 3.66 (с, 3H); 6.96~7.61 (м, 9H)
172	n-C ₃ H ₇	H	4-Cl	C ₂ H ₅	Масло	0.54~1.08 (м, 3H); 1.22 (т, 3H, J=7.4); 1.08~2.61 (м, 9H); 3.086-3.13 (2с, 2H); 4.15 (кв, 2H, J=7.4); 7.06 (д, 2H, J=9.8); 7.27 (д, 2H, J=9.8)
173	n-C ₄ H ₉	H	4-Cl	CH ₃	Масло ВР 160~172°C (0.3 мм Hg)	0.85 (т, 3H); 0.97~2.12 (м, 11H); 3.03, 3.03, 3.08 (2с, 2H); 3.62 (с, 3H); 6.92 (д, 2H, J=8); 7.13 (д, 2H, J=8)
174	n-C ₅ H ₁₁	H	4-Cl	CH ₃	Масло ВР 185~186°C (0.25 мм Hg)	0.86 (т, 3H); 0.98~2.32 (м, 13H); 3.05~3.16 (м, 2H); 3.69, 3.71 (2с, 3H); 7.04 (д, 2H, J=8.3); 7.22 (д, 2H, J=8.3)

Продолжение таблицы 5

Соединение	Радикалы в формуле (V)				Физические свойства	Спектр ЯРМ (CDCl ₃ , J м. д.)
	R ¹	R ²	X _n	R		
175	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	CH ₃	Масло	0.50~2.63 (м, 14H); 2.90 (д, 1H, J=14); 3.27 (д, 1H, J=14); 4.67 (с, 3H); 6.93~7.37 (м, 4H)
176	1-C ₃ H ₇	H	4-Cl	CH ₃	Масло	0.58~1.10 (м, 6H); 1.10-3.01 (м, 6H); 3.08-3.12 (2с, 2H); 3.71 (с, 3H); 6.84~7.30 (м, 4H)
177	1-C ₄ H ₉	H	4-Cl	CH ₃	Масло	0.82 (д, 3H, J=6); 0.89 (д, 3H, J=6); 1.04-3.00 (м, 8H); 3.07, 3.11 (2с, 2H); 3.69 (с, 3H); 6.77~7.24 (м, 4H)
178	CH ₃	C ₂ H ₅	4-Cl	CH ₃	Масло ВР 145~155°C (0.6 мм Hg)	0.58~1.17 (м, 6H); 1.17~2.87 (м, 6H); 3.05, 3.12 (2с, 2H); 3.70 (с, 3H); 7.03 (д, 2H, J=9); 7.25 (д, 2H, J=9)

Таблица 6

Соединение	Распыляемая концентрация, млн. д.	Эффект, %
1	2	3
1	125	100
2	125	100
3	125	95
4	125	100
5	125	100
6	125	100
7	125	95
8	125	95
9	125	100
10	125	100
11	125	100
12	125	90
13	125	100
14	125	100
15	125	95
16	125	100
17	125	95
18	125	100
19	125	100
20	125	50
21	125	100

Продолжение таблицы 6

1	2	3
22	125	100
23	125	100
24	125	100
25	125	100
26	125	100
27	125	100
28	125	100
29	125	100
30	125	100
31	125	100
32	125	100
33	125	100
34	125	100
35	125	100
36	125	100
37	125	100
38	125	100
39	125	100
40	125	100
41	125	100
42	125	100
43	125	95
44	125	100
45	125	100
46	125	95
47	125	100
48	125	100
49	125	100
50	125	100
51	125	100
52	125	100
53	125	75
54	125	100
55	125	100
56	125	100
57	125	100
58	125	100
59	125	100
60	125	100
61	125	100
62	125	100
63	125	100
64	125	100
65	125	100
66	125	100
67	125	100
68	125	100
69	125	100

Продолжение таблицы 6

1	2	3
70	125	100
71	125	100
72	125	100
73	125	100
74	125	100
75	125	100
76	125	100
Коммерческий продукт триадимефон	125	100
Контроль (не обработаны)		0

Примечание: триадимефон является коммерчески доступным материалом и содержит в качестве активного ингредиента соединение следующей формулы:

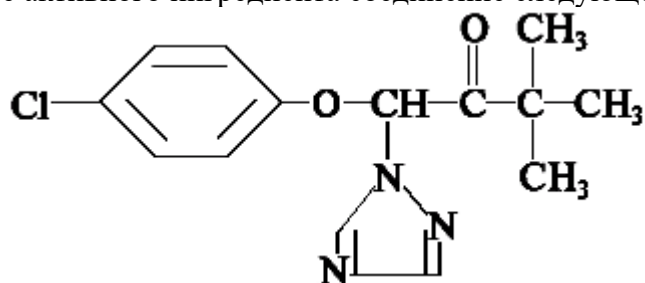


Таблица 7

Соединение	Распыляемая концентрация, млн.	Эффект, %
1	125	100
2	125	100
3	125	100
4	125	100
5	125	100
6	125	100
7	125	100
8	125	100
9	125	100
10	125	100
11	125	100
12	125	100
13	125	100
15	125	100
16	125	100
17	125	100
Коммерческий продукт триадимефон	125	100
Контроль (не обработаны)		0

Таблица 8

Соединение	Распыляемая концентрация, млн.	Эффект, %
1	2	3
1	125	100
2	125	95
3	125	100
4	125	95
5	125	100
6	125	100
7	125	100
8	125	95
9	125	100
10	125	100
11	125	100
12	125	95
13	125	100
14	125	100
15	125	100
16	125	100
17	125	95
18	125	100
19	125	100
20	125	100
21	125	100
22	125	100
23	125	70
24	125	100
25	125	95
26	125	100
27	125	100
28	125	100
29	125	100
30	125	100
31	125	100
32	125	100
33	125	100
34	125	100
35	125	100
36	125	100
37	125	100
38	125	100
39	125	100
40	125	100
41	125	100
42	125	100
43	125	100

Продолжение таблицы 8

1	2	3
44	125	100
45	125	100
46	125	100
47	125	100
48	125	100
49	125	90
50	125	100
51	125	100
52	125	100
53	125	95
54	125	100
55	125	100
56	125	100
57	125	100
58	125	90
59	125	100
60	125	90
61	125	90
62	125	100
63	125	100
64	125	100
65	125	100
66	125	100
67	125	100
68	125	100
69	125	100
70	125	100
71	125	100
72	125	100
73	125	100
74	125	100
75	125	90
76	125	90
Коммерческий продукт триадимефон		
Контроль (не обработаны)	125	95 0

Таблица 9

Соединение	Распыляемая концентрация, млн.	Эффект, %
1	2	3
1	500	100
2	500	100
3	500	90
4	500	80
5	500	100
6	500	100
7	500	70
8	500	70
9	500	100
10	500	100
11	500	85
12	500	80
13	500	100
14	500	100
15	500	90
16	500	100
17	500	80
18	500	100
19	500	100
21	500	100
22	500	65
23	500	100
24	500	90
25	500	85
27	500	100
28	500	90
29	500	100
30	500	100
31	500	60
32	500	100
33	500	85
37	500	100
38	500	100
39	500	75
41	500	100
42	500	100
44	500	100
45	500	100
46	500	70
47	500	60
48	500	100
49	500	100
50	500	100
54	500	100

Продолжение таблицы 9

Соединение	Распыляемая концентрация, млн. д.	Эффект, %
1	2	3
55	500	100
56	500	95
57	500	70
58	500	70
59	500	80
60	500	80
61	500	85
62	500	100
63	500	100
64	500	80
65	500	100
66	500	60
67	500	100
68	500	60
69	500	100
70	500	65
71	500	100
72	500	100
73	500	80
74	500	60
75	500	85
76	500	60
Коммерческий продукт (роврал)	500	100

Примечание: Коммерчески доступный материал (роврал), содержащий соединение, представленное следующей формулой, в качестве активного ингредиента

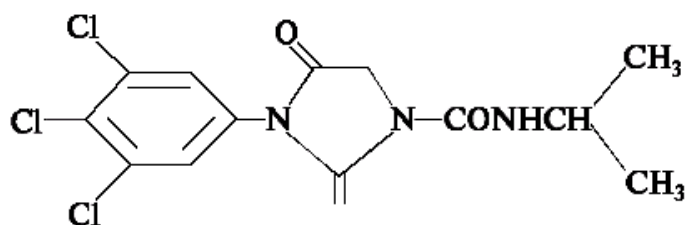


Таблица 10

Соединение	Распыляемая концентрация, млн.	Эффект, %
1	2	3
1	125	100
2	125	100
3	125	100
4	125	100
5	125	100
6	125	100
7	125	100
8	125	100
9	125	100
10	125	100
11	125	100
12	125	100
13	125	100
14	125	95
15	125	90
16	125	100
17	125	100
Коммерческий продукт роврал	125	85
Контроль (без обработки)		0

Таблица 11

Соеди- нение	Концентра- ция, мгк/мл	Испытуемые грибки																
		P.o.	C.m.	G.f.	H.s.	R.s.	Bo.c.	S.s.	F.n.	F.c.	F.r.	C.l.	C.b	S.c	V.m.	A.k.	A.m.	G.c.
1	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
3	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
4	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
5	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
6	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
7	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
8	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
9	100	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5
10	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
11	100	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
12	100	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
13	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5
14	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5
15	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
16	100	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
17	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5

Продолжение таблицы 11

Соединение	Концентрация, мгк/мл	Испытуемые грибки																
		P.o.	C.m.	G.f.	H.s.	R.s.	Bo.c.	S.s.	F.n.	F.c.	F.r.	C.l.	C.b.	S.c.	V.m.	A.k.	A.m.	G.c.
18	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
19	100	5	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5
20	100	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
21	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
22	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
23	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
24	100	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
25	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5
26	100	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
27	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5
28	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
29	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
30	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
31	100	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5
32	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5
33	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
34	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
35	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5

Продолжение таблицы 11

Соединение	Концентрация, мгк/мл	Испытуемые грибки																
		P.o.	C.m.	G.f.	H.s.	R.s.	Bo.c.	S.s.	F.n.	F.c	F.r	C.l	C.b	S.c	V.m	A.k.	A.m.	G.c.
36	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5	5
37	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
38	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
39	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
40	100	5	5	4	5	5	5	4	4	4	4	5	3	5	5	4	5	5
41	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5	5
42	100	5	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
43	100	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
44	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5
45	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
46	100	5	4	5	5	3	5	5	4	4	4	5	5	5	5	4	4	5
47	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5
48	100	5	5	4	5	5	4	4	4	4	4	5	5	5	5	4	5	5
49	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
50	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
51	100	5	4	5	5	4	5	5	4	4	4	5	4	5	5	4	4	5
52	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
53	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
54	100	5	5	5	5	4*	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	4	5

Продолжение табл. 11

Соединение	Концентрация, мгк/мл	Испытуемые грибки																
		P.o.	C.m.	G.f.	H.s.	R.s.	Bo.c.	S.s.	F.n.	F.c	F.r	C.l	C.b	S.c	V.m.	A.k.	A.m.	G.c.
55	100	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	4	5
56	100	5	4	5	5	4	5	5	4	4	4	5	3	5	5	3	3	5
57	100	5	4	5	5	4	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	4	5
58	100	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	3	3	5
59	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
60	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	4	5
61	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	4	5
62	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
63	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
64	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
65	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
66	100	5	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
67	100	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
68	100	5	5	5	5	3	5	5	4	4	4	5	5	5	5	4	4	5
69	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
70	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
71	100	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
75	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	4	5
76	100	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	4	5

Таблица 12

Соединение	Степень ограничения постоянной высоты, %	Фототоксичность
1	84.2	Нет
2	63.8	Тоже
3	71.8	„-“
4	70.0	„-“
5	70.0	„-“
6	74.6	„-“
7	85.9	„-“
8	72.3	„-“
9	75.7	„-“
10	79.7	„-“
11	76.8	„-“
12	67.2	„-“
13	87.0	„-“
14	76.8	„-“
15	77.4	„-“
16	84.2	„-“
17	76.8	„-“

Таблица 13

Соединение	Концентрация спрея, ч. на млн	Контрольная величина, %
1	125	100
2	125	100
3	125	100
4	125	95
5	125	100
9	125	100
13	125	95
14	125	90
15	125	95
16	125	100
18	125	100
23	125	100
24	125	100
29	125	100
30	125	100
33	125	100
37	125	100
38	125	100
50	125	100
63	125	100
69	125	100
71	125	100
Контроль (без обработки)	0	0

Таблица 14

Соединение	Концентрация спрея, ч. на млн.	Контрольная величина, %
1	125	100
2	125	95
3	125	100
4	125	95
5	125	100
9	125	100
13	125	100
14	125	100
15	125	95
16	125	100
18	125	100
23	125	100
24	125	100
29	125	100
30	125	100
33	125	100
37	125	100
38	125	100
50	125	100
63	125	100
69	125	100
71	125	100
Контроль (без обработки)	0	0

Таблица 15

Соединение	Концентрация спрея, ч. на млн.	Контрольная величина, %
1	125	100
2	125	95
3	125	100
4	125	95
5	125	100
9	125	100
13	125	95
14	125	95
15	125	100
16	125	100
18	125	100
23	125	100
24	125	100
29	125	100
30	125	100
33	125	100

Продолжение таблицы 15

Соединение	Концентрация спрея, ч. на млн.	Контрольная величина, %
37	125	100
38	125	100
50	125	100
63	125	100
69	125	100
71	125	100
Контроль (без обработки)	0	0

Таблица 16

Соединение	Концентрация спрея, ч. на млн.	Контрольная величина, %
1	125	100
2	125	95
3	125	100
4	125	95
5	125	100
9	125	100
13	125	95
14	125	95
15	125	100
16	125	100
18	125	100
23	125	100
24	125	100
29	125	100
30	125	100
33	125	100
37	125	100
38	125	100
50	125	100
63	125	100
69	125	100
71	125	100
Контроль (без обработки)	0	0

Таблица 17

Соединение	Относительный показатель ограничения	Испытуемое соединение	Относительный показатель ограничения роста, %
1	2	3	4
1	81.5	27	85.5
2	63.5	28	83.2
3	70.3	29	69.4
4	65.0	30	72.7
5	63.5	31	69.3
6	74.0	32	65.5
7	83.5	33	64.2
8	70.3	34	63.6
9	75.0	35	61.4
10	70.0	36	59.8
11	70.5	37	59.4
12	70.3	38	65.4
13	84.0	39	60.2
14	70.0	40	67.5
15	72.5	41	65.3
16	84.0	42	71.2
17	76.5	43	65.6
18	84.7	44	75.4
19	72.2	45	68.2
20	74.5	46	66.3
21	78.8	47	62.7
22	76.4	48	65.9
23	80.8	49	64.0
24	76.0	50	63.7
25	75.2	51	57.8
26	73.5	52	55.2
53	62.1	65	67.3
54	66.8	66	60.6
55	80.5	67	61.7
56	74.7	68	56.8
57	72.3	69	65.2
58	70.4	70	63.4
59	61.2	71	60.5
60	76.2	72	80.6
61	72.7	73	71.6
62	66.5	74	70.4
63	77.7	75	75.5
64	62.4	76	70.1

Таблица 18

Испытуемое соединение	Применяемое количество, кг/га	Контрольная величина, %
1	3	100
2	3	100
3	3	100
4	3	100
5	3	100
9	3	100
13	3	90
14	3	90
15	3	90
16	3	100
18	3	100
23	3	100
24	3	95
29	3	100
30	3	100
33	3	100
37	3	100
38	3	100
50	3	100
63	3	100
69	3	100
71	3	100
Контроль (без обработки)	0	0

Таблица 19

Испытуемое соединение	Применяемое количество, кг/га	Контрольная величина, %
1	3	100
2	3	100
3	3	100
4	3	100
5	3	100
9	3	100
13	3	100
14	3	95
15	3	90
16	3	100
18	3	100
23	3	100
24	3	95
29	3	100

Продолжение табл. 19

1	2	3
30	3	100
33	3	100
37	3	100
38	3	100
50	3	100
63	3	100
69	3	100
71	3	100
Контроль (без обработки)	0	0

Таблица 20

Испытуемое соединение	Применяемое количество,	Контрольная величина, %
1	3	100
2	3	90
3	3	100
4	3	85
5	3	100
9	3	100
13	3	80
14	3	80
15	3	85
16	3	100
18	3	100
23	3	100
24	3	85
29	3	100
30	3	100
37	3	95
38	3	100
50	3	100
63	3	100
69	3	100
71	3	100
Контроль (без обработки)	0	0

Таблица 21

Испытуемое соединение	Применяемое количество, кг/га	Контрольная величина, %
1	3	100
2	3	98
3	3	100
4	3	90
5	3	100
9	3	100
13	3	90
14	3	95
15	3	85
16	3	100
18	3	100
23	3	100
24	3	95
29	3	95
30	3	100
33	3	100
37	3	95
38		100
50	3	100
63	3	100
69	3	100
71	3	100
Контроль (без обработки)	0	0

Таблица 22

Испытуемое соединение	Применяемое количество, г/ящик	Показатель ограничения роста, %
1	25	24.3
2	25	12.2
3	25	10.5
4	25	5.5
5	25	23.9
9	25	27.8
13	25	10.4
14	25	8.4
15	25	7.2
16	25	20.3
18	25	25.2
23	25	18.9
24	25	15.3
29	25	7.2
30	25	19.7
33	25	8.5

37	25	9.2
38	25	11.5
50	25	5.2
63	25	12.7
69	25	6.4
71	25	7.2

Таблица 23

Испытуемое соединение	Концентрация спрея, ч. на млн.	Показатель ограничения роста, %
1	50	19.3
2	50	8.4
3	50	7.7
4	50	5.2
5	50	20.1
9	50	27.1
13	50	11.3
14	50	7.5
15	50	7.9
16	50	15.5
18	50	19.5
23	50	12.7
24	50	11.5
29	50	5.1
30	50	14.2
33	50	6.7
37	50	7.1
38	50	9.4
50	50	4.6
63	50	8.8
69	50	4.2
71	50	4.3

Таблица 24

Испытуемое соединение	Применяемое количество, % по весу (сухие семена)	Показатель ограничения роста, %
1	0.5	31.5
2	0.5	17.3
3	0.5	13.4
4	0.5	10.7
5	0.5	33.5
9	0.5	36.4
13	0.5	15.6
14	0.5	13.3
15	0.5	13.7
16	0.5	27.8
18	0.5	31.1
23	0.5	27.4
24	0.5	20.3
29	0.5	11.9
30	0.5	25.4
33	0.5	10.9
37	0.5	15.4
38	0.5	21.3
50	0.5	9.3
63	0.5	27.0
69	0.5	13.8
71	0.5	10.2

Таблица 25

Испытуемое соединение согласно табл. 1	Контрольная величина, %	
	Концентрация спрея (препарат для опрыскивания), ч./млн.	
	7.8	15.6
1	100	100
3	75	100
9	100	100
16	85	90
55	90	95
A*	30	70
B*	30	50
C*	20	65
D*	0	10

Примечание: * Сравнительный пример.

Соединения А, В, С и Д- активные ингредиенты композиций для сравнения.

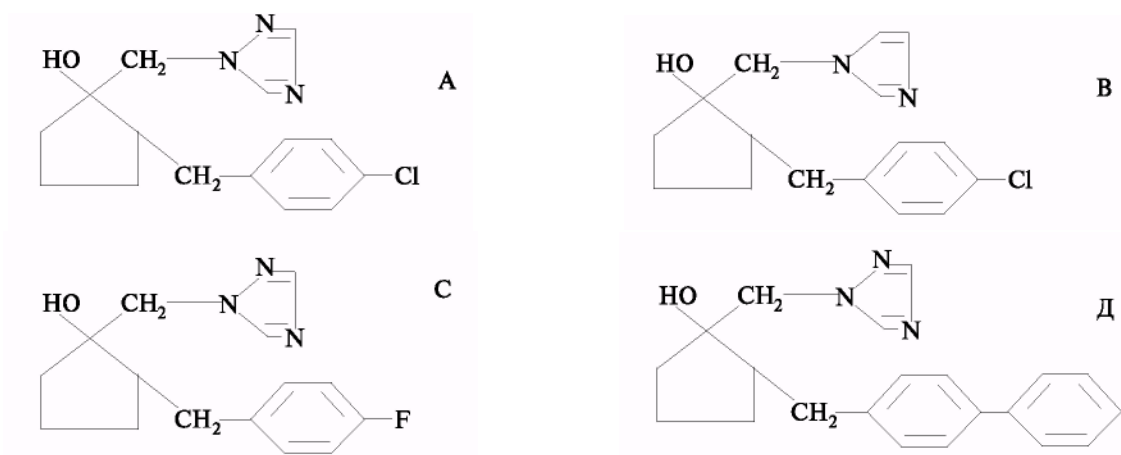


Таблица 26

Соединение (№ в табл. 1)	Концентрация спрея (част./млн)	Контрольная величина, %
13	500	100
15	500	90
48	500	100
49	500	100
E*	500	15
F*	500	10
G*	500	10
H*	500	30
		40

Примечание: * сравнительный пример.

Таблица 27

Соединение	Концентрация спрея, ч. на млн.	Контрольная величина, %
1	2	3
1	125	100
2	125	100
3	125	100
4	125	95
5	125	100
9	125	100
13	125	95
14	125	90
15	125	90
16	125	95
18	125	100
23	125	100
24	125	95
29	125	100
30	125	100
33	125	100
37	125	100
38	125	100

50	125	100
63	125	100
69	125	100
71	125	100

Таблица 28

Соединение	Концентрация спрея, част./млн.	Контрольная величина, %
1	2	3
1	125	100
2	125	100
3	125	95
4	125	100
5	125	100
9	125	95
13	125	90
14	125	90
15	125	100
16	125	100
18	125	100
23	125	95
24	125	100
29	125	100
30	125	100

Продолжение таблицы 28

Соединение	Концентрация спрея,	Контрольная величина, %
1	2	3
33	125	100
37	125	100
38	125	100
50	125	100
63	125	100
69	125	100
71	125	100

Таблица 29

Соединение	Концентрация спрея, част./млн.	Показатель сдерживания высоты растений, %
1	50	18.5
2	50	11.5
3	50	8.8
4	50	6.7
5	50	21.3
9	50	30.1
13	50	19.7
14	50	11.5
15	50	12.6
16	50	23.4
18	50	21.5
23	50	15.6
24	50	5.5
29	50	4.2
30	50	7.2
33	50	5.1
37	50	5.0
38	50	7.8
50	50	4.2
63	50	8.0
69	50	5.4
71	50	7.1

Таблица 30

Испытуемое соединение	Применяемое количество, кг/га	Контрольная величина, %
1	6	100
2	6	100
3	6	99
4	6	99
5	6	100
9	6	100
13	6	88
14	6	90
15	6	85
16	6	100
18	6	100
23	6	100
24	6	90
29	6	100
30	6	100
33	6	100
37	6	100
38	6	100
50	6	100
63	6	100

69	6	100
71	6	100

Таблица 31

Испытуемое соединение	Применяемое количество, кг/га	Показатель(контрольная величина, %
1	6	100
2	6	100
3	6	100
4	6	95
5	6	100
9	6	100
13	6	90
14	6	90
15	6	90
16	6	100
18	6	100
23	6	100
24	6	95
29	6	100
30	6	100
33	6	100
37	6	100
38	6	100
50	6	100
63	6	100
69	6	100
71	6	100

Таблица 32

Соединение	Количество (сухие семена), мас. %	Показатель сдерживания высоты растений, %
1	0.5	15.5
2	0.5	10.1
3	0.5	7.5
4	0.5	7.0
5	0.5	18.1
9	0.5	19.5
13	0.5	10.5
14	0.5	9.7
15	0.5	9.5
16	0.5	11.7
18	0.5	20.5
23	0.5	17.8
24	0.5	12.3
29	0.5	5.5
30	0.5	9.7
33	0.5	5.4
37	0.5	7.2
38	0.5	11.4
50	0.5	3.3

63	0.5	12.8
69	0.5	7.6
71	0.5	5.5

Таблица 33

Испытуемое соединение	Концентрация спрея, ч. на млн.	Контрольная величина, %
1	2	3
1	125	100
2	125	100
3	125	100
4	125	99
5	125	100
9	125	100
13	125	95
14	125	90
15	125	95
16	125	100
18	125	100
23	125	100
24	125	95
29	125	100
30	125	100
33	125	100
37	125	100
38	125	100
50	125	100
63	125	100
69	125	100
71	125	100

Таблица 34

Испытуемое соединение	Концентрация спрея, ч. на млн.	Контрольная величина, %
1	125	100
2	125	100
3	125	100
4	125	100
5	125	95
9	125	100
13	125	100
14	125	100
15	125	95
16	125	100
18	125	100
23	125	100
24	125	100
29	125	100
30	125	100
33	125	100
37	125	100
38	125	100
50	125	100

63	125	100
69	125	100
71	125	100

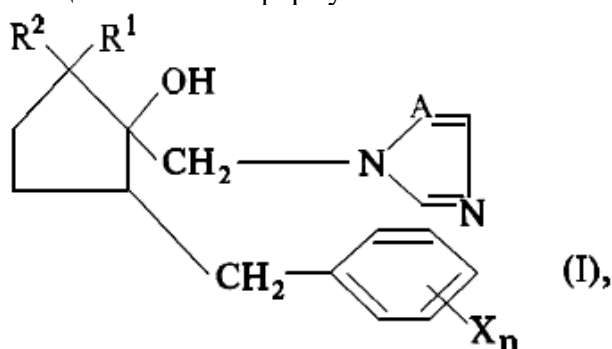
Таблица 35

Испытуемое соединение	Концентрация спрея, ч. / млн.	Показатель сдерживания высоты растения, %
1	50	20.0
2	50	10.2
3	50	7.5
4	50	4.8
5	50	19.8
9	50	25.6
13	50	15.7
14	50	10.8
15	50	11.7
16	50	21.6
18	50	22.3
23	50	17.6
24	50	9.8
29	50	4.1
30	50	10.7
33	50	5.5
37	50	5.2
38	50	7.5
50	50	3.2
63	50	7.7
69	50	3.3
71	50	3.5

Формула изобретения

1. Производные азола формулы 1

Производные метилениклопентана формулы 3



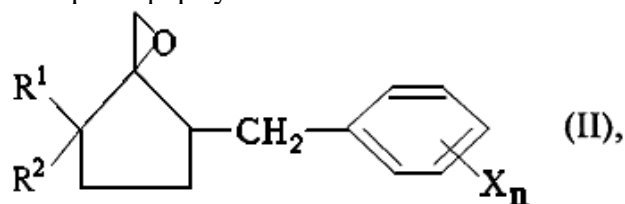
где R^1 и R^2 - водород или C_1-C_5 - алкил, при условии, что оба одновременно не могут быть водородом; X - галоген, C_1-C_5 - алкил или фенил; $n \div 0 \div 2$; A - азот или группа $-CH-$.

2. Производные азола формулы 1 по п. 1, отличающиеся тем, что R^1 - водород или C_1-C_3 - алкил; R^2 - водород или C_1-C_3 - алкил, при условии, что оба одновременно не могут быть водородом; X - галоген в 4-положении бензольного кольца; $n = 1$; A - азот или группа $-CH-$.

3. Производные азола формулы 1 по п. 1, отличающиеся тем, что R^1 и R^2 –

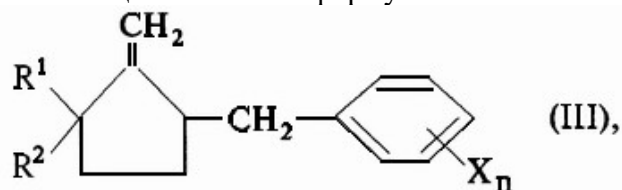
водород или C_1-C_3 - алкил, при условии, что оба одновременно не могут быть водородом; X - галоген в 4-положении бензольного кольца; $n = 1$; A - азот.

4. Производные оксирана формулы 2

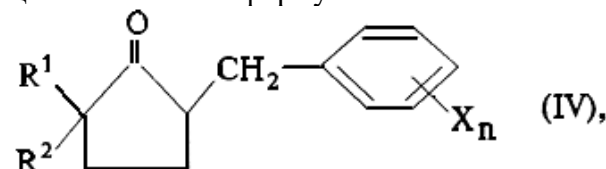


где R^1-R^2 - водород или C_1-C_5 - алкил, при условии, что оба одновременно не могут быть водородом; X-галоген, C_1-C_5 - алкил или фенил; $n = 0 \div 2$, в качестве промежуточных продуктов для получения производных азола формулы 1.

5. Производные метиленикклопентана формулы 3

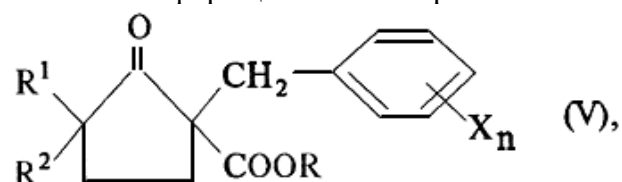


6. Производные циклопентанона формулы 4



где R^1 и R^2 - водород или C_1-C_5 - алкил, при условии, что оба одновременно не могут быть водородом; X-галоген, C_1-C_5 - алкил или фенил; $n = 0 \div 2$, в качестве промежуточных продуктов для получения производных азола формулы 1.

7. Производные сложно го эфира циклопентакарбоновой кислоты формулы 5



-где $R-C_1-C_5$ - алкил R^1 и R^2 - водород или C_1-C_5 - алкил, при условии, что оба одновременно не могут быть водородом; X - галоген, C_1-C_5 - алкил или фенил; $n = 0 \div 2$, в качестве промежуточных продуктов для получения производных азола формулы 1.

Составитель описания
Ответственный за выпуск

Никифорова М.Д.
Ногай С.А