

(19)



(10) **LT 3730 B**

(12) **PATENTO APRAŠYMAS**

(11) Patent numeris: **3730**

(51) Int. Cl.⁵: **C07C 69/73**

(21) Paraiškos numeris: **IP935**

C07D 213/44

(22) Paraiškos padavimo data: **1993 09 03**

C07D 239/24

(41) Paraiškos paskelbimo data: **1995 03 27**

C07D 241/10

(45) Patent paskelbimo data: **1996 02 26**

C07D 215/00

C07D 249/08

(60) SU duomenys: **SU 4742511, 1989 11 20**

A01N 33/24

A01N 37/10

A01N 43/40

A01N 43/54

A01N 43/60

A01N 43/653

(31, 32, 33) Prioritetas: **8827149, 1988 11 21, GB**
8905383, 1989 03 09, GB

(72) Išradėjas:

Paul John de Fraine, GB
Anne Martin, GB

(73) Patent savininkas:

ZENECA Limited, 15 Stanhope Gate, London W1Y 6LN, GB

(74) Patentinis patikėtinis:

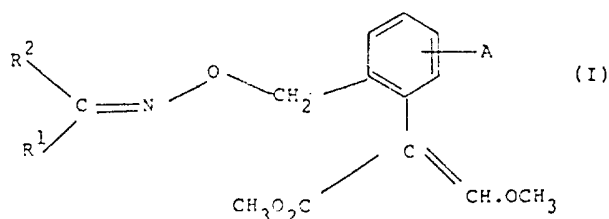
Marius Jakulis-Jason, 3, A.A.A. Baltic Service Company,
Rūdninkų g. 18/2-12, 2001 Vilnius, LT

(54) Pavadinimas:

Propeno rūgšties dariniai, jų gavimo būdai, kompozicijos ir kovos su grybeliais, vabzdžiais arba erkėmis būdas

(57) Referatas:

Aprašomi junginiai, kurių formulė (I)



ir jų stereioizomerai, kur A yra vandenilis, halogenas, hidroksilas, C_{1-4} alkilas, C_{1-4} alkoksi, C_{1-4} halogenalkilas, C_{1-4} alkilkarbonilas, C_{1-4} alkoksikarbonilas, fenoksi, nitro arba ciano;

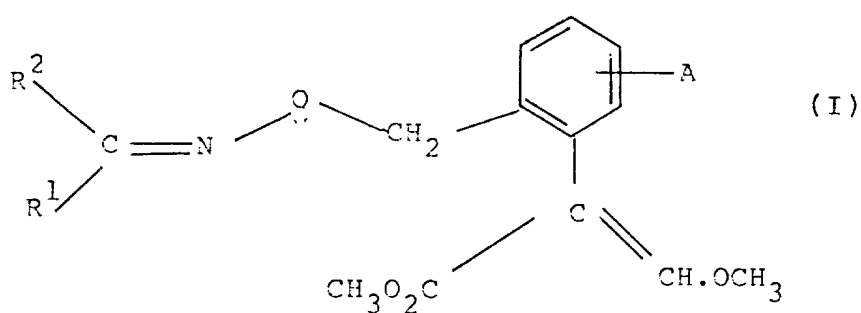
R^1 ir R^2 , kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis, galimai pakeistas alkilas, galimai pakeistas cikloalkilas, galimai pakeistas heteroalkilas, galimai pakeistas cikloalkilalkilas, galimai pakeistas aralkilas, galimai pakeistas heteroarilalkilas, galimai pakeistas ariloksialkilas, galimai pakeistas alkenilas, galimai pakeistas alkinilas, galimai pakeistas alkoksi, galimai pakeistas arilas, galimai pakeistas heteroarilas, galimai pakeistas ariloksi, galimai pakeistas heteroariloksi, nitro, halogenas, ciano, - NR^3R^4 , - CO_2R^3 , - $CONR^3R^4$, - COR^3 , - $S(O)_nR^3$, kur n yra 0, 1 arba 2, $(CH_2)_mPO(OR^3)_2$, kur m yra 0 arba 1, arba R^1 ir R^2 sujungti, sudarant karbociklinę arba heterociklinę žiedinę sistemą; ir

R^3 ir R^4 , kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis, galimai pakeistas alkilas, galimai pakeistas alkenilas, galimai pakeistas alkinilas, galimai pakeistas arilas arba galimai pakeistas heteroarilas.

Junginiai pasižymi fungicidiniu, insekticidiniu ir miticidiniu aktyvumu.

Šis išradimas skirtas propeno rūgšties dariniams, naudojamiems kaip fungicidai, insekticidai ir miticidai, jų gavimo būdams, kompozicijoms, kurių sudėtyje yra šių darinių, jų panaudojimo kovai su grybeliais, ypač su grybelinėmis augalų infekcijomis, naikinimui arba kovai su vabzdžiais ar erkėmis būdams.

Pagal šį išradimą pateikiamas junginys, kurio formulė (I):



ir jo stereoisomerai, kur A yra vandenilis, halogenas, hidroksilas, C_{1-4} alkilas, C_{1-4} alkoksi, C_{1-4} halogenalkilas, C_{1-4} halogenalkoksi, C_{1-4} alkilkarbonilas, C_{1-4} alkoksikarbonilas, fenoksi, nitro arba ciano; R^1 ir R^2 , kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis, galimai pakeistas alkilas, galimai pakeistas cikloalkilas, galimai pakeistas heterocikloalkilas, galimai pakeis-

tas cikloalkilalkilas, galimai pakeistas aralkilas, galimai pakeistas heteroarilalkilas, galimai pakeistas ariloksialkilas, galimai pakeistas heteroariloksialkilas, galimai pakeistas alkenilas, galimai pakeistas alkinilas, galimai pakeistas alkoksi, galimai pakeistas arilas, galimai pakeistas heteroarilas, galimai pakeistas ariloksi, galimai pakeistas heteroariloksi, nitro, halo, ciano, $-NR^3R^4$, $-CO_2R^3$, $-CONR^3R^4$, $-COR^3$, $-S(O)_nR^3$, kur n yra 0, 1 arba 2, $(CH_2)_mPO(OR^3)_2$, kur m yra 0 arba 1, arba R^1 ir R^2 sujungti, sudarant karbociklinę arba heterociklinę žiedinę sistemą; R^3 ir R^4 , kurie gali būti tie patys arba skirtingi, yra vandenilis, galimai pakeistas alkilas, galimai pakeistas aralkilas, galimai pakeistas alkenilas, galimai pakeistas alkinilas, galimai pakeistas arilas arba galimai pakeistas heteroarilas.

Išradimo junginiai turi bent vieną anglies-azoto dvigubą jungtį ir bent vieną anglies-anglies dvigubą jungtį ir kartais gaunami geometrinių izomerų mišinio pavidalo. Tačiau šie mišiniai gali būti suskaidyti į atskirus izomerus, ir šis išradimas apima šiuos izomerus bei jų mišinius bet kokiais santykiais.

Atskiri izomerai, kurie yra propenoatinės grupės ir oksimo nesimetriškai pakeistos dvigubos jungties rezultatas, žymimi paprastai naudojamais simboliais "E" ir "Z". Šie simboliai nusakomi pagal sistemą Cahn-Ingold-Prelog, kuri išsamiai aprašyta literatūroje (žiūrėti, pavyzdžiui, J. March "Advanced Organic Chemistry" ("Šiuolaikinė organinė chemija"), 3 leid., Wiley-Interscience, 109 p. ir toliau).

Dėl propenoatinės grupės dvigubos jungties anglis-anglis vienas izomeras paprastai labiau aktyvus kaip fungicidas, negu kitas, ir labiau aktyvus paprastai yra tas izomeras, kuriame grupės $-CO_2CH_3$ ir $-OCH_3$ yra priešingose propenoatinės grupės olefini -

ninės jungties pusėse ((E)-izomeras). Šie (E)-izomerai atstovauja įgyvendinimą, kuriam teikiama pirmenybė.

Halogenas apima fluorą, chlorą, bromą ir jodą.

Alkilas, ir alkoksi, aralkilo bei ariloksialkilo grupių alkiliniai fragmentai gali būti linijinių arba šakotų grandinių pavidalo, ir jei kitaip nenurodyta, atitinkamai turi nuo 1 iki 6 anglies atomų. Kaip pavyzdžiai gali būti metilas, etilas, izopropilas ir tretbutilas. Galimi pakaitai apima halogeną (ypač chlorą ir fluorą), hidroksi ir C_{1-4} alkoksi. Pakeisto alkilo ir pakeisto alkoksi pavyzdžiai yra trifluormetilas ir trifluorometoksi.

Cikloalkilas atitinkamai yra C_{3-6} cikloalkilas, pavyzdžiui, ciklopropilas ir cikloheksilas, ir cikloalkilalkilas atitinkamai yra C_{3-6} cikloalkil(C_{1-4})alkilas, pavyzdžiui, ciklopropil-etilas.

Alkenilas ir alkinilas atitinkamai turi nuo 2 iki 6 anglies atomų, būdingu atveju nuo 2 iki 4 anglies atomų, ir yra linijinių arba šakotų grandinių pavidalo. Kaip pavyzdžiai yra etenilas, alilas, propargilas. Pakeistos alkenilinės ir alkinilinės grupės apima galimai pakeistus arilalkenilą (ypač galimai pakeistą feniletenilą) ir arilalkinilą.

Arilas ir aralkilo, arilalkenilo, arilalkinilo, ariloksi ir ariloksialkilo ariliniai fragmentai apima fenilą ir naftilą.

Karbociklinė arba heterociklinė žiedinė sistema, kurią gali sudaryti kartu R^1 ir R^2 , yra atitinkama C_{5-10} alifatinė, aromatinė arba mišri alifatinė/aromatinė karbociklinė žiedinė sistema, pavyzdžiui, ciklopentilas, cikloheksilas, cikloheksadienonilas ir tokios grupės, nešančios kondensuotą benzolo žie-

da ir/arba pakaitus, tokius kaip metilas; arba ji gali būti 5-10 narių heterociklinė žiedinė sistema, pavyzdžiui, tetrahidropiranas.

Terminas "heteroarilas" naudojamas aromatinių heterociklinių grupių aprašymui. Heteroarilas bei heterociklilas ir heteroariliniai bei heterocikliliniai kitų grupių, tokių kaip heteroariloksialkilas ir heterocikloalkilas, fragmentai būdingu atveju yra penkianariai arba šešianariai žiedai, turintys vieną arba daugiau O, N arba S heteroatomų, kurie gali būti kondensuoti su vienu ar daugiau kitų aromatinių, heteroaromatinių arba heterociklinių žiedų, tokių kaip benzolo žiedas. Kaip pavyzdžiai yra tienilo, furilo, pirolilo, triazolilo, tiazolilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, triazinilo, chinolinilo ir chinoksalinilo grupės ir jų N-oksidai.

Pakaitai, kurie gali būti galimai pakeistame arba heteroariliniame fragmente, apima vieną ar daugiau tokių pakaitų: halogenas, hidroksi, merkaptas, C_{1-4} alkilas (ypač metilas arba etilas), C_{2-4} alkenilas (ypač alilas), C_{2-4} alkinilas (ypač propargilas), C_{1-4} alkoksi (ypač metoksi), C_{2-4} alkeniloksi (ypač aliloksi), C_{2-4} alkiniloksi (ypač propargiloksi), halogen(C_{1-4})alkilas (ypač trifluormetilas), halogen(C_{1-4})alkoksi (ypač trifluormetoksi), C_{1-4} alkiltio (ypač metiltio), hidroksi(C_{1-4})alkilas, C_{1-4} alkoksi(C_{1-4})alkilas, C_{3-6} cikloalkilas, C_{3-6} cikloalkil(C_{1-4})-alkilas, galimai pakeistas arilas (ypač galimai pakeistas fenilas), galimai pakeistas heteroarilas (ypač galimai pakeistas piridilas arba pirimidinilas), galimai pakeistas ariloksi (ypač galimai pakeistas fenoksi), galimai pakeistas heteroariloksi (ypač galimai pakeistas piridiloksi arba pirimidiniloksi), galimai pakeistas aril(C_{1-4})alkilas (ypač galimai pakeistas benzilas, galimai pakeistas fenetilas ir galimai pakeistas fenilo n-propilas), kuriuose alkilinis fragmentas galimai pakeis-

tas hidroksi grupe, galimai pakeistas heteroaril(C_{1-4})alkilas (ypač galimai pakeistas piridil- arba pirimidinil(C_{1-4})alkilas), galimai pakeistas aril(C_{2-4})alkenilas (ypač galimai pakeistas heteroaril(C_{2-4})alkenilas (ypač galimai pakeistas piridiletėnilas arba pirimidiniletėnilas), galimai pakeistas aril(C_{1-4})alkoksi (ypač galimai pakeistas benziloksi), galimai pakeistas heteroaril(C_{1-4})alkoksi (ypač galimai pakeistas piridil- arba pirimidinil(C_{1-4})alkoksi), galimai pakeistas piridil- arba pirimidinil(C_{1-4})alkoksi, galimai pakeistas ariloksi(C_{1-4})alkilas (ypač fenoksimetilas), galimai pakeistas heteroariloksi(C_{1-4})alkilas (ypač galimai pakeistas piridiloksi- arba pirimidiloksi(C_{1-4})alkilas), aciloksi, apimantis C_{1-4} alkanoiloksi (ypač acetiloksi) ir bezoiloksi, ciano, tiocianato, nitro, $-NHCOR'$, $-NR'R''$, $-NHCONR'R''$, $-CONR'R''$, $-COOR'$, $-OSO_2R'$, $-SO_2R'$, $-SO_2R'$, $-CR'=NR''$ arba $-N=CR'R''$, kur R' ir R'' nepriklausomai yra vandenilis, C_{1-4} alkilas, C_{1-4} alkoksi, C_{1-4} alkiltio, C_{3-6} cikloalkilas, C_{3-6} cikloalkil(C_{1-4})alkilas, fenilas arba benzilas, be to, fenilinė arba benzilinė grupės yra galimai pakeistos halogenų, C_{1-4} alkilu arba C_{1-4} alkoksi.

Pakaitai, kurie gali būti bet kurių iš anksčiau išvardintų pakaitų ariliniame arba heteroariliniame žieduose, apima vieną ar daugiau tokių pakaitų: halogenas, hidroksi, merkaptas, C_{1-4} alkilas, C_{2-4} alkenilas, C_{2-4} alkinilas, C_{1-4} alkoksi, C_{2-4} alkeniloksi, C_{2-4} alkiniloksi, halogen(C_{1-4})alkilas, halogen(C_{1-4})alkoksi, C_{1-4} alkiltio, hidroksi(C_{1-4})alkilas, C_{1-4} alkoksi(C_{1-4})alkilas, C_{3-6} cikloalkilas, C_{3-6} cikloalkil(C_{1-4})alkilas, alkanoiloksi, benzoiloksi, ciano, tiocianato, nitro, $-NR'R''$, $-NHCOR'$, $-NHCONR'R''$, $-CONR'R''$, $-COOR'$, $-SO_2R'$, $-OSO_2R'$, $-COR'$, $-CR'=NR''$ arba $-N=CR'R''$, kur R' ir R'' įgyja reikšmes, nurodytas aukščiau.

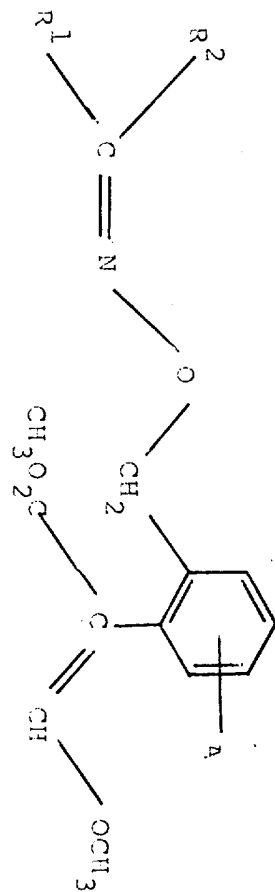
Pagal vieną aspektą šis išradimas apima (I) formulės jun-

gini, kuriame A yra vandenilis, halogenas, hidroksi, metilas, metoksi, trifluormetilas, trifluormetoksi, C_{1-2} alkilkarbonilas, C_{1-2} alkoksikarbonilas, fenoksi, nitro arba ciano; R^1 yra C_{1-4} alkilas, halogen(C_{1-4}) alkilas, C_{1-4} alkoksi, halogen(C_{1-4}) alkoksi, C_{1-4} alkilkarbonilas, C_{1-4} alkoksikarbonilas, ciano, fenil (C_{1-4}) alkilas, fenilas, penkianaris arba šešianaris aromatinis heterociklas, turintis vieną arba daugiau O, N arba S atomų ir galimai kondensuotas su benzolo žiedu, be to, aromatiniai heteroaromatiniai bet kurių aukščiau nurodytų grupių fragmentai yra paprastai pakeisti vienu ar daugiau iš tokių: halogenas, hidroksi, C_{1-4} alkilas, halogen(C_{1-4}) alkilas, C_{1-4} alkoksi, halogen(C_{1-4}) alkoksi, C_{1-4} alkilkarbonilas, C_{1-4} alkoksikarbonilas, nitro, ciano, fenilas, fenoksi, benzilas arba benziloksi; R^2 yra vandenilis, halogenas, C_{1-4} alkilas, halogen(C_{1-4}) alkilas, C_{1-4} alkilkarbonilas, C_{1-4} alkoksikarbonilas, ciano arba fenilas; arba R^1 ir R^2 sujungti kartu, sudarant C_{5-10} karbociklinę žiedinę sistemą.

Pagal kitą aspektą į išradimą įeina (I) formulės junginys, kuriam A yra vandenilis arba halogenas; R^1 yra C_{1-4} alkilas, benzilas, C_{1-4} alkilkarbonilas, C_{1-4} alkoksikarbonilas, ciano, fenilas, tienilas, triazolilas, tiazolilas, piridilas, pirimidinilas, pirazinilas, piridazinilas, triazinilas, chinolinilas arba chinoksalinilas, ir bet kurie iš aukščiau nurodytų grupių aromatinių arba heteroaromatinių fragmentų yra galimai pakeisti vienu ar daugiau iš tokių pakaitų: halogenas, C_{1-4} alkilas, trifluormetilas, C_{1-4} alkoksi, trifluormetoksi, nitro, ciano, fenilas arba benziloksi; R^2 yra vandenilis, C_{1-4} alkilas, C_{1-4} alkilkarbonilas, C_{1-4} alkoksikarbonilas, ciano arba fenilas; arba R^1 ir R^2 sujungti drauge, sudarant ciklopentilo arba cikloheksilo žiedą, su kuriuo galimai kondensuotas benzolo žiedas.

Ši išradimą iliustruoja junginiai, išvardinti 1 Lentelėje, kuri pateikta žemiau. 1 Lentelėje metil-3-metoksipropenoato grupė yra (E)-konfigūracijos.

1 lentelė



Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis [⊕]	Lyđ. t. O _C	Izomerų santykis ++
1	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄	H	H	8,50	7,60	aliejus	
2	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄	H	H	8,05	7,60	aliejus	
3	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	H	H				
4	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	H				
5	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	H	8,05	7,59	aliejus	
5	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	H	8,07	7,60	aliejus	19:1
7	2-F-C ₆ H ₄	H	H				
8	3-F-C ₆ H ₄	H	H				
9	4-F-C ₆ H ₄	H	H				
10	2-Cl-C ₆ H ₄	H	H				
11	3-Cl-C ₆ H ₄	H	H	8,04	7,59	aliejus	

1 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis [⊙]	Lyd. t. oC	Izomerų santykis++
12	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H				
13	2-Br-C ₆ H ₄	H	H				
14	3-Br-C ₆ H ₄	H	H				
15	4-Br-C ₆ H ₄	H	H				
16	2-NO ₂ -C ₆ H ₄	H	H				
17	3-NO ₂ -C ₆ H ₄	H	H	8,14	7,61	aliejus	
18	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	H	H				
19	2-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	H	8,12	7,60	aliejus	
20	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	H				
21	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	H	8,10	7,60 7,59	63-6 aliejus	
22	C ₆ H ₅	H	H				
23	C ₆ H ₅	CH ₃	H				
24	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H				
25	2-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄	H	H				
26	3-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄	H	H				
27	4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄	H	H				

1 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis [⊖]	Lyđ. t. OC	Izomerų santykis ⁺⁺
28	2-(C ₆ H ₅ CH ₂ O)-C ₆ H ₄	H	H				
29	3-(C ₆ H ₅ CH ₂ O)-C ₆ H ₄	H	H	8,06	7,60	aliejus	
30	4-(C ₆ H ₅ CH ₂ O)-C ₆ H ₄	H	H				
31	2-ciano-C ₆ H ₄	H	H				
32	3-ciano-C ₆ H ₄	H	H	8,07	7,60	aliejus	
33	4-ciano-C ₆ H ₄	H	H				
34	2-CF ₃ O-C ₆ H ₄	H	H				
35	3-CF ₃ O-C ₆ H ₄	H	H				
36	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄	H	H				
37	pirid-2-ilas	H	H	8,19	7,60	aliejus	
38	pirid-3-ilas	H	H	8,10	7,60	aliejus	
39	pirid-4-ilas	H	H	8,03	7,61	110,5- 111,5	
40	pirid-2-ilas	CH ₃	H		7,60	aliejus	
41	pirid-2-ilas	ciano	H		7,63	144-6	
42	pirid-2-ilas	CO ₂ C ₂ H ₅	H		7,55	aliejus	
43	pirid-2-ilas	CO ₂ CH ₃	H				
44	pirimidin-2-ilas	H	H				
45	pirimidin-4-ilas	H	H	8,07	7,61	96-9	

1 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis [⊕]	Lyd. t. °C	Izomery santykis ⁺⁺
46	tien-2-ilas	H	H				
47	tien-2-ilas	CH ₃	H				
48	5-Cl-tien-2-ilas	H	H		7,58	aliejus	16:1
49	CO ₂ C ₂ H ₅	CO ₂ C ₂ H ₅	H				
50	CO ₂ CH ₃	CO ₂ CH ₃	H		7,58	aliejus	
51	COCH ₃	COCH ₃	H				
52	ciano	ciano	H				
53	∅	∅	H				
54	∅	∅	H				
55	∅	∅	H		7,58	aliejus	
56	tret-C ₄ H ₉	H	H				
57	C ₆ H ₅ CH ₂	H	H				
58	2,4-di-Cl-C ₆ H ₃	H	H				
59	2,4-di-F-C ₆ H ₃	H	H				
60	3,5-di-CH ₃ -C ₆ H ₃	H	H				
61	3,5-di-CH ₃ O-C ₆ H ₃	H	H				
62	pirazin-2-ilas	CH ₃	H		7,61	116-118,5	
63	6-CH ₃ -pirid-3-ilas	CH ₃	H		7,60	67-73	

1 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis [⊕]	Lyd. t. °C	Izomery santykis ++
64	pirid-2-ilas	C ₂ H ₅	H		7,60	70-80	24:1
65	pirid-3-ilas	CH ₃	H		7,60	aliejus	
66	pirimidin-5-ilas	izo-C ₃ H ₇	H		7,60	aliejus	
67	izo-C ₃ H ₇	pirimidin-5-ilas	H		7,53	aliejus	
68	pirid-4-ilas	CH ₃	H				
69	6-Cl-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
70	5-Cl-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
71	4-Cl-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
72	3-Cl-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
73	6-ciano-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
74	5-ciano-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
75	4-ciano-pirid-2-ilas	CH ₃	H		7,61	98-99	
76	3-ciano-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
77	6-Br-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
78	5-Br-pirid-2-ilas	CH ₃	H				

1 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis [⊕]	Lyd. t. °C	Izomerų santykis++
79	4-Br-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
80	3-Br-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
81	6-CH ₃ pirid-2-ilas	CH ₃	H				
82	5-CH ₃ -pirid-2-ilas	CH ₃	H				
83	4-CH ₃ pirid-2-ilas	CH ₃	H				
84	3-CH ₃ pirid-2-ilas	CH ₃	H				
85	6-F-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
86	5-F-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
87	4-F-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
88	3-F-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
89	3-CH ₃ -pirazin-2-ilas	CH ₃	H		7,60	106-8	
90	3-C ₂ H ₅ -pirazin-2-ilas	CH ₃	H		7,59	74-76,5	
91	3-Cl-pirazin-2-ilas	CH ₃	H				
92	3-OCH ₃ -pirazin-2-ilas	CH ₃	H		7,58	aliejus	
93	5-CO ₂ CH ₃ -pirazin-2-ilas	CH ₃	H		7,60	aliejus	4:1

1 Lentele (tęsinys)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis [⊕]	Lyđ. t. O _C	Izomery santykis**
94	5-CO ₂ C ₂ H ₅ -pirazin-2-ilas	CH ₃	H				
95	3-ciano-pirazin-2-ilas	CH ₃	H				
96	pirimidin-4-ilas	CH ₃	H				
97	2-Cl-pirimidin-4-ilas	CH ₃	H				
98	2-OCH ₃ -pirimidin-4-ilas	CH ₃	H				
99	2-CH ₃ -pirimidin-4-ilas	CH ₃	H				
100	2-ciano-pirimidin-4-ilas	CH ₃	H				
101	tiazol-2-ilas	CH ₃	H		7,60	107-114	10:1
102	tien-3-ilas	CH ₃	H		7,60	aliejus	
103	5-Cl-tien-2-ilas	CH ₃	H				
104	5-CH ₃ -tien-2-ilas	CH ₃	H				
105	5-Br-tien-2-ilas	CH ₃	H				
106	5-ciano-tien-2-ilas	CH ₃	H				
107	3-CH ₃ -tien-2-ilas	CH ₃	H				
108	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,57	aliejus	

1 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis®	Lyd. t. °C	Izomerų santykis ⁺⁺
109	C-OCH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,57	85-7	
110	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,58	aliejus	
111	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,58	aliejus	
112	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,58	aliejus	
113	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,59	aliejus	
114	2-F-C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,60	aliejus	
115	3-F-C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,59	aliejus	
116	4-F-C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,59	aliejus	
117	2-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	H				
118	3-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,59	aliejus	
119	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	H				
120	2-Br-C ₆ H ₄	CH ₃	H				
121	3-Br-C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,59	aliejus	
122	4-Br-C ₆ H ₄	CH ₃	H				
123	2-NO ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,59	70-72	
124	3-NO ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	H				
125	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,60	100-2	
126	2-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H				

1 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis [⊗]	Lyđ. t. O _C	Izomerų santykis++
127	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,60	aliejus	
128	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H				
129	2-ciano-C ₆ H ₄	CH ₃	H				
130	3-ciano-C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,60	75,5-77	
131	4-ciano-C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,59	aliejus	
132	3,4,5-(OCN) ₃ -C ₆ H ₂	CH ₃	H				
133	3,5-di-F-pirid-2-ilas	CH ₃	H				
134	3,4,5,6-F ₄ -piridin-2-ilas	CH ₃	H				
135	2,6-di-Cl-pirid-3-ilas	CH ₃	H				
136	piridazin-3-ilas	CH ₃	H				
137	piridazin-4-ilas	CH ₃	H				
138	6-CH ₃ -piridazin-3-ilas	CH ₃	H				
139	4-ciano-chinolin-2-ilas	CH ₃	H		7,63	160,5-162	
140	chinoksalin-2-ilas	CH ₃	H		7,62	179-181	
141	C ₆ H ₅	CH ₃	6-F				
142	C ₆ H ₅	CH ₃	6-Cl				
143	6-CH ₃ -pirimidin-4-ilas	CH ₃	H		7,60	aliejus	

LT 3730 B

1 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis⊕	Lyđ. t. o _C	Izomerų santykis††
144	4-CH ₃ -pirimidin-5-ilas	CH ₃	H		7,58	aliejus	6:1
145	4-CH ₃ -pirimidin-2-ilas	CH ₃	H		7,57	aliejus	
146	4,6-di-CH ₃ -pirimidin-2-ilas	CH ₃	H				
147	2,6-di-CH ₃ -pirimidin-4-ilas	CH ₃	H				
148	2,4-di-CH ₃ -pirimidin-5-ilas	CH ₃	H				
149	6-Cl-pirimidin-4-ilas	CH ₃					
150	6-OCH ₃ -pirimidin-4-ilas	CH ₃	H				
151	4,6-di-OCH ₃ -pirimidin-2-ilas	CH ₃	H				
152	Ø	Ø	H		7,58	aliejus	
153	Ø	Ø	H		7,58	109-110	
154	N-oksid-pirid-2-ilas	CH ₃	H		7,52	aliejus	78 55 aliejus 114-116
155	5-C ₂ H ₅ -pirid-2-ilas	CH ₃	H				
156	CH ₃ CO	CH ₃	H		7,59		
157	C ₆ H ₅ CO	CH ₃	H		7,56		
158	N-CH ₃ -pirol-2-ilas	CH ₃	H		7,57	aliejus	
159	4-Cl-chinolin-2-ilas	CH ₃	H		7,62	114-116	

1 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis®	Lyđ. t. o _C	Izomerų santykis ++
160	2,4-di-Cl-C ₆ H ₃	1,2,4-triazol-1-il-CH ₂	H		7,61	aliejus	
161	2,4-di-Cl-C ₆ H ₃	1,2,4-triazol-1-il-CH ₂	H			aliejus	
162	2,4-di-CH ₃ -triazol-5-ilas	CH ₃	H		7,58	aliejus	
163	furan-2-ilas	CH ₃	H		7,58	aliejus	
164	2,4-di-CH ₃ -furan-3-ilas	CH ₃	H				
165	pirid-2-ilas	pirid-2-ilas	H		7,55	aliejus	
166	6-C ₆ H ₅ -pirimidin-4-ilas	CH ₃	H				
167	4-ciano-pirid-3-ilas	CH ₃	H				
168	1,2,4-triazin-5-ilas	CH ₃	H				
169	3-CH ₃ -1,2,4-triazin-5-ilas	CH ₃	H				
170	3-C ₆ H ₅ -1,2,4-triazin-5-ilas	CH ₃	H				
171	3-SCH ₃ -1,2,4-triazin-5-ilas	CH ₃	H				
172	3-OCH ₃ -1,2,4-triazin-5-ilas	CH ₃	H				
173	5-CONH ₂ -pirazin-2-ilas	CH ₃	H		7,60	146-8	3:1
174	5-ciano-pirazin-2-ilas	CH ₃	H		7,62	89-92	

1 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis [⊕]	Lyd. t. °C	Izomerų santykis ^{+,†}
175	5,6-di-CH ₃ -pirazin-2-ilas	CH ₃	H		7,60	114-6	7:3
176	3,5-di-CH ₃ -pirazin-2-ilas	CH ₃	H		7,59	56-60	
177	3,6-di-CH ₃ -pirazin-2-ilas	CH ₃	H		7,59	aliejus	
178	5-CH ₃ -pirazin-2-ilas	CH ₃	H				8:1
179	6-CH ₃ -pirazin-2-ilas	CH ₃	H				
180	5-Cl-pirazin-2-ilas	CH ₃	H				
181	6-Cl-pirazin-2-ilas	CH ₃	H				
182	5,6-diciano-pirazin-2-ilas	CH ₃	H				
183	4-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,59	aliejus	
184	4-NH ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	H		7,58	aliejus	
185	2,4-di-Cl-C ₆ H ₃	CH ₃	H		7,60	79-82	
186	2,4-di-CH ₃ -C ₆ H ₃	CH ₃	H		7,57	56-68,5	
187	4-NHCONH ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	H				
188	C ₆ H ₅	ciklopropilas	H		7,57	aliejus	8:1
189	C ₆ H ₅	Cl	H				
190	4-C ₂ H ₅ O-C ₆	CF ₃	H		7,55	aliejus	

1 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis [⊗]	Lyđ. t. O _C	Izomerų santykis ++
191	C ₆ H ₅	SC ₂ H ₃	H		7,57	aliejus	
192	C ₆ H ₅	F	H				
193	C ₆ H ₅	OC ₂ H ₅	H				
194	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H		7,57	aliejus	
195	cikloheksil-CH ₂	CH ₃	H				
196	C ₆ H ₅ -CH ₂	CH ₃	H		7,57	aliejus	
197	pirazin-2-il-CH ₂	CH ₃	H				
198	(E)-C ₆ H ₅ -CH=CH	CH ₃	H		7,58	aliejus	
199	C ₆ H ₅ -OCH ₂	CH ₃	H				
200	C ₆ H ₅	CH ₂ Cl	H				
201	benziazol-2-ilas	CH ₃	H				
202	benzoksazol-2-ilas	CH ₃	H				
203	pirazin-2-ilas	CH ₃	H				
204	5-OCH ₃ -pirazin-2-ilas	C ₂ H ₅	H				
205	6-OCH ₃ -pirazin-2-ilas	CH ₃	H				
206	6-ciano-pirazin-2-ilas	CH ₃	H				
207	5-ciano-pirid-3-ilas	CH ₃	H				
208	6-ciano-pirid-3-ilas	CH ₃	H				
209	3-ciano-pirid-4-ilas	CH ₃	H				

LT 3730 B

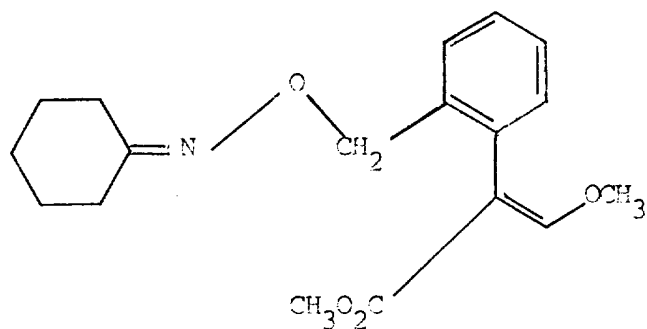
1 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis [⊕]	Lyđ. t. o _C	Izomerų santykis ⁺⁺
210	2-ciano-pirid-4-ilas	CH ₃	H				
211	pirimidin-5-ilas	CH ₃	H				
212	2-CH ₃ -pirimidin-5-ilas	CH ₃	H				
213	3-OCH ₃ -izoksazol-5-ilas	CH ₃	H				
214	3-Pr-izoksazol-5-ilas	CH ₃	H				
215	5-NO ₂ -tiazol-5-ilas	CH ₃	H				
216	5-CH ₃ -tiazol-2-ilas	CH ₃	H				
217	4-CH ₃ -tiazol-5-ilas	CH ₃	H				
218	2-Cl,4-CH ₃ -tiazol-5-ilas	CH ₃	H				
219	3,5-di-OCH ₃ -1,2,4-triazin-6-ilas	CH ₃	H				
220	3,6-di-CH ₃ piridazin-4-ilas	CH ₃	H				
221	2-(C ₆ H ₅ O)-C ₆ H ₄	CH ₃	H				
222	3-(C ₆ H ₅ O)-C ₆ H ₄	CH ₃	H				
223	4-(C ₆ H ₅ O)-C ₆ H ₄	CH ₃	H				
224	1,2,4-triazol-1-il-CH ₂	CH ₃	H				

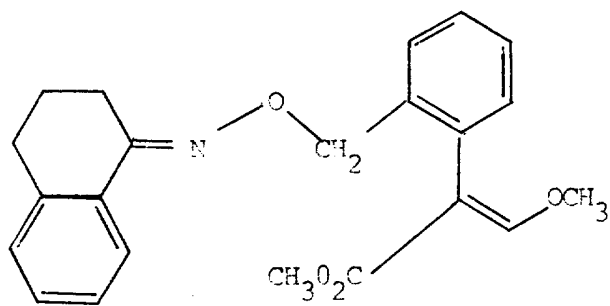
1 Lentele (tešiny)

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Oksimas*	Olefininis [⊕]	Lyd. t. °C	Izomerų santykis ++
225	C ₆ H ₅	OCH ₃	H		7,53	deriva	
226	OCH ₃	C ₆ H ₅	H		7,58	deriva	
227	C ₆ H ₅	CH ₃ S(d)	H		7,60	deriva	
228	C ₆ H ₅	CH ₃ S(d) ₂	H		7,60	deriva	
229	C ₆ H ₅	N(CH ₃) ₂	H				
230	C ₆ H ₅ O	CH ₃	H				
231	C ₆ H ₅	Br	H				
232	C ₆ H ₅	I	H				

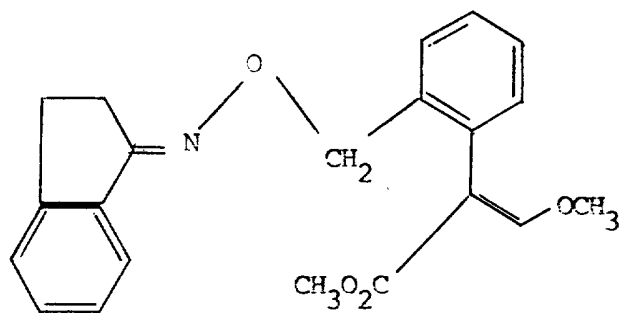
53 junginys yra:



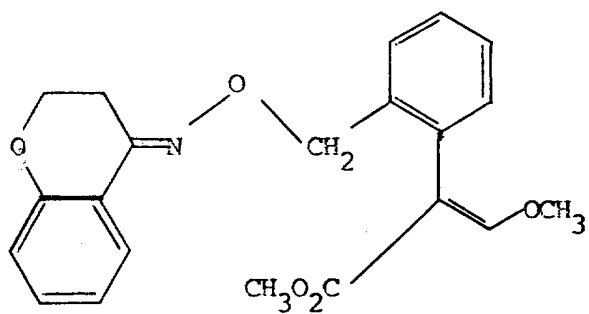
54 junginys yra:



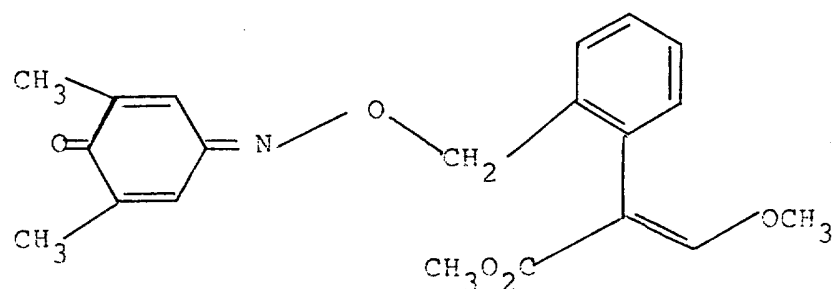
55 junginys yra:



152 junginys yra:



153 Junginys yra:



1 lentelės tęsinys

Junginio Nr.	R ¹	R ²	A	Olefini- nis [⊕]	Lyd.t. °C	Izomerų santykis ⁺⁺
233	C ₆ H ₅	(CH ₃)CH ₃	H			
234	pirimidin-2- ilas	CH ₃ O	H			
235	pirazin-2-ilas	Cl	H			

Paiškinimai:

★ Cheminis singleto poslinkis nuo olefininio protono pagrindi -
nio oksim-eferinio izomero β-metoksipropenatinėje grupėje
(milij. dal. iš tetrametilsilano).

⊕ Cheminis singleto poslinkis nuo protono aldoksime, kur tai
atitinka.

++ Izomerų, kurie yra nesimetriškai pakeisto oksimo dvigubas
jungties rezultatas.

Ø Grupės R¹ ir R² sujungtos, sudarant žiedą.

2 Lentelė: Pasirinkto protono BMR duomenys

2 Lentelėje pateikti pasirinkto protono BMR duomenys kai
kuriems junginiamas, išvardintiems 1 Lentelėje. Cheminiai pos-
linkiai matuoti milij dalyų (m.d.) iš tetrametilsilano, o kaip
tirpiklis visur buvo naudojamas deuteriochloroformas. Stulpelv-

LT 3730 B

je, pavadintame "dažnis", nurodytas darbinis BMR spektrometro dažnis. Naudojami tokie sutrumpinimai:

pl = platus

s = singletas

d = dubletas

t = tripletas

kv = kvartetas

m = multipletas

Junginio Dažnis		
Nr.	(MHz)	
1.	2.	3.
1	270	33,69 (3H, s), 3,82 (3H, s), 3,83 (3H, s), 5,12 (2H, s), 6,84-6,99 (2H, m), 7,11-7,2 (1H, m), 7,25-7,4 (3H, m), 7,5-7,62 (1H,m), 7,60 (1H, s), 7,74-7,8 (1H, m), 8,50 (1H,s) m.d.
2	400	3,70 (3H, s), 3,80 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,13 (2H, s), 6,9-7,54 (8H, m), 7,60(1H,s) m.d.
6	270	(pagrindinis izomeras) 2,36 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,80 (3H, s), 5,10 (2H, s), 7,1- 7,5 (3H, m), 7,60 (1H, s), 8,07 (1H, s) m.d.
11	270	3,70 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,14 (2H, s), 7,15-7,20 (1H, m), 7,24-7,43 (5H, m), 7,48- 7,54 (1H, m), 7,58-7,62 (1H, m), 7,59 (1H,s), 8,04 (1H, s) m.d.
17	270	3,70 (3H, s), 3,84 (3H, s), 5,17 (2H, s), 7,16-7,22 (1H, m), 7,32-7,39 (2H, m), 7,49-

LT 3730 B

		7,58 (2H, m), 7,60 (1H, s), 7,88 (1H, d), 8,14 (1H, s), 8,17-8,23 (1H, m), 8,42 (1H, m) m.d.
20	270	3,70 (3H, s), 3,83 (3H, s), 5,16 (2H, s), 7,14-7,20 (1H, m), 7,31-7,38 (2H, m), 7,46-7,55 (2H, m), 7,55-7,64 (1H, m), 7,60 (1H, s), 7,7-7,77 (1H, d), 7,83 (1H, s), 8,12 (1H, s) m.d.
23	270	2,25 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,16 (2H, s), 7,13-7,20 (1H, m), 7,3-7,4 (5H, m), 7,5-7,55 (1H, m), 7,59 (1H, s), 7,6-7,66 (2H, m) m.d.
29	270	3,68 (3H, s), 3,80 (3H, s), 5,08 (2H, s), 5,13 (2H, s), 6,94-7,07 (1H, m), 7,07-7,56 (12H, m), 7,60 (1H, s), 8,06 (1H, s) m.d.
32	270	3,70 (3H, s), 3,83 (3H, s), 5,14 (2H, s), 7,1-7,9 (8H, m), 7,60 (1H, s), 8,07 (1H, s) m.d.
37	270	3,69 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,18 (2H, s), 7,15-7,82 (7H, m), 7,60 (1H, s), 8,19 (1H, s), 8,6 (1H, m) m.d.
38	270	3,69 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,14 (2H, s), 7,14-7,53 (5H, m), 7,60 (1H, s), 7,90- 7,96 (1H, m), 8,10 (1H, s), 8,55-8,62 (1H, m), 8,72 (1H, m) m.d.
40	270	2,34 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,19 (2H, s), 7,1-7,7 (6H, m), 7,60 (1H, s), 7,89 (1H, d), 8,59 (1H, d), m.d.

LT 3730 B

42	270	1,32-1,40 (3H, t), 3,63 (3H, s), 3,77 (3H, s), 4,33-4,44 (2H, kv), 5,25 (2H, s), 7,13-7,20 (1H, m), 7,26-7,42 (4H, m), 7,56 (1H, s), 7,7-7,77 (2H, m), 7,66-7,71 (1H, m) m.d.
47	270	2,24 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,11 (2H, s), 6,9-7,55 (7H, m), 7,58 (3H, s) m.d.
49	270	1,3 (6H, kv), 3,70 (3H, s), 3,83 (3H, s), 4,36 (4H, kv), 5,23 (2H, s), 7,1-7,5 (4H, m), 7,58 (1H, s) m.d.
55	270	2,85-3,12 (4H, m), 3,69 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,14 (2H, s), 7,1-7,7 (8H, m), 7,58 (1H, s) m.d.
65	270	(pagrindinis izomeras) 2,24 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,16 (2H, s), 7,1-7,5 (5H, m), 7,60 (1H, s), 7,9 (1H, m), 8,57 (1H, m), 8,83 (1H, m) m.d.
66	270	1,22 (6H, d), 3,57 (1H, m), 3,69 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,13 (2H, s), 7,1-7,5 (4H, m), 7,60 (1H, s), 3,81 (2H, s), 9,18 (1H, s), m.d.
67	270	1,14 (6H, d), 2,83 (1H, m), 3,66 (3H, s), 3,78 (3H, s), 5,00 (2H, s), 7,1-7,4 (4H, m), 7,53 (1H, s), 8,66 (2H, s), 9,17 (1H, s) m.d.
92	270	2,26 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,80 (3H, s), 4,00 (3H, s), 5,21 (3H, s), 7,1-7,6 (4H, m), 7,58 (1H, s),

2 Lentelė (tęsinys)

1.	2.	3.
		8,08 (1H,d), 8,16 (1H, d) m.d.
93	270	(pagrindinis izomeras) 2,30 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,83 (3H, s), 4,03 (3H, s), 5,24 (2H, s), 7,1-7,55 (4H, m), 7,50 (1H, s), 9,20 (1H, m), 9,23 (1H, m), (antraeilis izomeras) 2,30 (3H, s), 3,64 (3H, s), 3,80 (3H, s), 4,03 (3H, s), 5,12 (2H, s), 7,1-7,55 (4H, m), 7,57 (1H, s), 9,32 (1H, m), 9,37 (1H, m) m.d.
102	270	2,22 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,88 (3H, s), 3,12 (2H, s), 7,15-7,55 (7H, m), 7,60 (1H, s) m.d.
108	270	2,20 (3H, s), 3,67 (3H, s), 3,80 (3H, s), 3,83 (3H, s), 5,14 (2H, s), 6,87-7,60 (8H, m), 7,57 (1H, s) m.d.
111	270	2,20 (3H, s), 2,30 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,80 (3H, s), 5,13 (2H, s), 7,15-7,4 (7H, m), 7,54 (1H, m), 7,58 (1H, s) m.d.
112	270	2,23 (3H, s), 2,37 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,16 (2H, s), 7,1-7,55 (8H, m), 7,58 (1H, s) m.d.
113	270	2,22 (3H, s), 2,35 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,13 (3H, s), 7,1-7,5 (8H, m), 7,58 (1H, s) m.d.

2 Lentelė (tęsinys)

LT 3730 B

1.	2.	3.
114	270	2,26 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,16 (2H, s), 7,0-7,55 (8H, m), 7,59 (1H, s) m.d.
115	270	2,02 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,15 (2H, s), 7,0-7,55 (8H, m), 7,60 (1H, s) m.d.
116	270	2,22 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,13 (2H, s), 6,99-7,65 (8H, m), 7,59 (1H, s) m.d.
118	270	2,21 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,16 (2H, s), 7,14-7,66 (8H, m), 7,59 (1H, s) m.d.
121	270	2,21 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,16 (2H, s), 7,1-7,55 (7H, m), 7,59 (1H, s), 7,81 (1H, m) m.d.
127	270	2,26 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,83 (3H, s), 5,18 (2H, s), 7,15-7,92 (8H, m), 7,60 (1H, s) m.d.
131	270	2,22 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,18 (2H, s), 7,1-7,8 (8H, m), 5,59 (1H, s), m.d.
143	270	(pagrindinis izomeras) 2,28 (3H, s), 2,53 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,83 (3H, s), 5,22 (2H, s), 7,1-7,5 (4H, m), 7,60 (1H, s), 7,72 (1H, s), 9,06 (1H, s) m.d. (pagrindinis izomeras) 2,27 (3H, s),

2 Lentelė (tęsinys)

1.	2.	3.
		2,48 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,83 (3H, s), 5,21 (2H, s), 7,1-7,5 (4H, m), 7,61 (1H, s), 7,77 (1H, s), 9,10 (1H, s) m.d.
144	270	(pagrindinis izomeras) 2,22 (3H, s), 2,50 (3H, s), 3,67 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,14 (2H, s), 7,1-7,5 (4H, m), 7,58 (1H, s), 8,53 (1H, s), 9,02 (1H, s), m.d. (pagrindinis izomeras) 2,17 (3H, s), 2,40 (3H, s), 3,65 (3H, s), 3,77 (3H, s), 5,00 (2H, s), 7,1-7,5 (4H, m), 7,52 (1H, s), 8,37 (1H, s), 9,05 (1H, s), m.d.
145	270	2,39 (3H, s), 2,57 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,33 (2H, s), 7,11 (1H, d), 7,1-7,55 (4H, m), 7,57 (1H, s), 8,64 (1H, d) m.d.
152	270	2,92 (2H, t), 3,68 (3H, s), 3,82 (3H, s), 4,18 (2H, t), 5,14 (2H, s), 6,8-7,0 (2H, m), 7,1-7,5 (5H, m), 7,58 (1H, s), 7,87 (1H, m) m.d.
154	270	2,22 (3H, s), 3,61 (3H, s), 3,75 (3H, s), 5,08 (2H, s), 7,0-7,5 (7H, m), 7,52 (1H, s), 8,12 (1H, m) m.d.
158	270	2,08 (3H, s), 3,67 (6H, s), 3,80 (3H, s), 5,06 (2H, s), 6,08 (1H, m), 6,38 (1H, m),

LT 3730 B

2 Lentelė (tesinys)

1.	2.	3.
		6,06 (1H, m), 7,1-7,5 (4H, m), 7,57 (1H, s) m.d.
160	270	3,69 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,19 (2H, s), 5,42 (2H, s), 7,1-7,5 (7H, m), 7,61 (1H, s), 7,77 (1H, s), 8,05 (1H, s), m.d.
162	270	2,21 (3H, s), 2,46 (3H, s), 2,62 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,10 (2H, s), 7,1-7,5 (4H, m), 7,58 (1H, s) m.d.
163	270	2,16 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,17 (2H, s), 6,42 (1H, m), 6,61 (1H, m), 7,1-7,55 (6H, m), 7,58 (1H, s), m.d.
165	270	8,63 (3H, s), 3,76 (3H, s), 5,22 (2H, s), 7,1-7,8 (10H, m), 7,56 (1H, s), 8,55 (1H, d), 8,70 (1H, d), m.d.
177	270	2,29 (3H, s), 2,71 (3H, s), 2,53 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,81 (3H, s), 5,15 (2H, s), 7,1-7,5 (4H, m), 7,59 (1H, s), 8,24 (1H, s) m.d.
183	270	2,24 (3H, s), 3,03 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,20 (2H, s), 7,1-7,5 (4H, m), 7,59 (1H, s), 7,8-8,0 (4H, m) m.d.
184	270	2,18 (3H, s), 3,67 (3H, s), 3,78 (3H, s), 3,80 (2H, pl.s), 5,11 (2H, s), 6,59 (2H, d), 7,1-7,55 (6H, m), 7,58 (1H, s) m.d.

2 Lentelė (tęsinys)

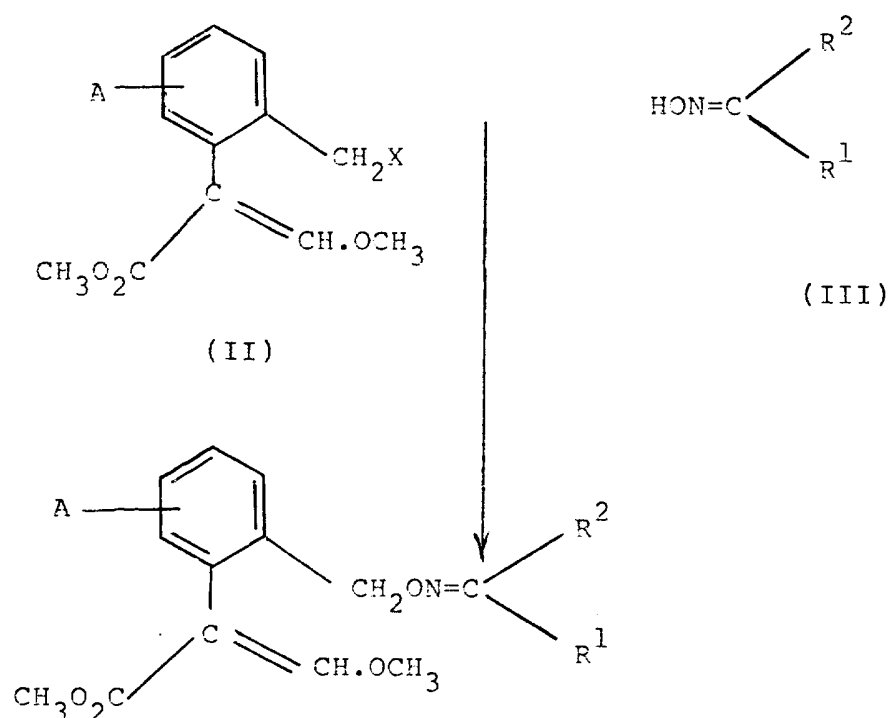
1.	2.	3
188	270	(pagrindinis izomeras) 0,65 (2H, m), 0,90 (2H, m), 2,32 (1H, m), 3,67 (3H, s), 3,80 (3H, s), 5,13 (2H, s), 7,1-7,6 (9H, m), 7,57 (1H, s) m.d. (antraeilis izomeras) 0,65 (2H, m), 2,32 (1H, m), 3,63 (3H, s), 3,76 (3H, s), 4,97 (2H, s), 7,1-7,6 (9H, m), 7,77 (1H, s) m.d.
190	270	1,41 (3H, t), 3,64 (3H, s), 3,76 (3H, s), 4,05 (2H, kv.), 5,18 (2H, s), 6,8-7,55 (8H, m), 7,55 (1H, s) m.d.
191	270	2,04 (3H, s), 3,66 (3H, s), 3,78 (3H, s), 5,19 (2H, s), 7,1-7,4 (8H, m), 7,5-7,6 (1H, m), 7,57 (1H, s) m.d.
194	270	1,10 (9H, s), 1,81 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,81 (3H, s), 4,99 (2H, s), 7,1-7,5 (4H, m), 7,57 (1H, s) m.d.
196	270	1,76 (3H, s), 3,46 (2H, s), 3,67 (3H, s), 3,80 (3H, s), 5,06 (2H, s), 7,1-7,5 (9H, m), 7,57 (1H, s) m.d.
198	270	2,10 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,11 (2H, s), 6,85 (2H, s), 7,1-7,5 (9H, m), 7,58 (1H, s) m.d.
225	270	3,60 (3H, s), 3,70 (3H, s), 3,78 (3H, s), 4,94 (2H, s), 7,1-7,5 (7H, m), 7,53 (1H, s), 7,77-7,81 (2H, m) m.d.

2 Lentelė (tęsinys)

1.	2.	3.
226	270	3,66 (3H, s), 3,77 (3H, s), 3,98 (3H, s), 5,04 (2H, s), 7,10-7,58 (7H, m), 7,58 (1H, s), 7,60-7,70 (2H, m) m.d.
227	270	2,88 (3H, s), 3,67 (3H, s), 3,79 (3H, s), 5,18 (2H, dd), 7,1-7,5 (7H, m), 7,60 (1H, s), 7,6-7,7 (2H, m) m.d.
228	270	3,20 (3H, s), 3,67 (3H, s), 3,80 (3H, s), 5,30 (2H, s), 7,1-7,6 (9H, m), 7,60 (1H, s) m.d.

Išradimo (I) formulės junginiai gali būti gauti būdu, kuris parodytas I-oje scemoje. Simboliai A, R¹ ir R² yra tokie, kaip apibrėžta aukščiau, X yra atskylanti grupė, tokia kaip halogenas (chloras, bromas arba jodas).

I schema



LT 3730 B

(I) formulės junginiai gali būti gauti apdorojant (III) bendros formulės oksimus tinkama baze (tokia, kaip natrio hidridas arba natrio metilatas) tinkamame tirpiklyje (tokiame kaip N,N-dimetilfarmamidas arba tetrahidrofuranas), susidarant anijonui, po to pridedant (II) formulės junginio.

(III) bendros formulės oksimai gerai žinomi cheminėje literatūroje. (II) bendros formulės junginys, kuriam X yra bromas ir propenoatinė grupė yra (E)-konfigūracijos, aprašytas EP-A-0203606.

Alternatyviai išradimo (I) formulės junginiai gali būti gauti būdu, parodytu 2 schemeje. Simbolių A, R^1 , R^2 ir X reikšmės yra tokios, kaip apibrėžta aukščiau, R^5 yra vandenilis arba metalas (toks kaip natriis arba kalis), I yra atskiriama grupė, tokia kaip halogeninė (chloridas, bromidas arba jodidas), CH_3SO_4 anijonas arba sulfonilinis anijonas. Kiekviena transformacija atliekama tinkamoje temperatūroje ir paprastai, nors nevisada, tinkamame tirpiklyje.

Išradimo (I) formulės junginiai gali būti gauti iš (VI) formulės fenilacetatų arba sudėtinių (X) formulės ketoeterių būdu, pavaizduotu 2 schemeje

Tuo būdu (I) formulės junginiai gali būti gauti, apdirbant (VI) formulės fenilacetatus baze (tokia kaip natrio hidridas arba natrio metilatas) ir metilformatu. Jei į reakcijos mišinį paskui pridedama formulės CH_3L junginio, kur L yra toks, kaip apibrėžta aukščiau, gali būti gauti (I) formulės junginiai. Jei į reakcijos mišinį pridedama protono rūgšties, gaunami (IX) formulės junginiai, kur R^5 yra vandenilis. Alternatyviai (IX) formulės junginiai, kur R^5 yra metalas (toks kaip natriis), gali patys savaime išsiskirti iš reakcijos mišinio.

LT 3730 B

(IX) formulės junginiai, kuriems R^5 yra metalas, gali būti paverčiami (I) formulės junginiais, paveikiant junginiu CH_3L , kur L toks, kaip apibrėžta aukščiau. (IX) formulės junginiai, kur R^5 - vandenilis, gali būti paverčiami (I) formulės junginiais, nuosekliai paveikiant baze (tokia kaip kalio karbonatas) ir bendros formulės CH_3L junginiu.

Alternatyviai (I) formulės junginiai gali būti gauti iš (IV) formulės acetalų, atskiriant metanolį arba rūgštinėse, arba bazinėse sąlygose. Reagentų arba reagentų mišinių pavyzdžiai, kurie gali būti naudojami duotai transformacijai, yra ličio-diizopropilamidas; rūgštinis kalio sulfatas (žiūrėti, pavyzdžiui, T.Uamao, H.Hagiwara, H.Uda, J.Chem. Soc. Chemical Communication, 1980, 838 ir šio darbo literatūros nuorodas); ir trietilaminas, dažnai dalyvaujant Lewes rūgščiai, tokiai kaip titano tetrachloridas (žiūrėti, pavyzdžiui, K.Usunda and L.Heresi, J. Chem. Soc. Chemical Communication, 1985 (1000)).

(IV) formulės acetalai gali būti gauti, apdirbant (V) formulės metil-silil-keten-acetalus, kur R yra alkilinė grupė, trimetilortoformiatu, dalyvaujant Lewes rūgščiai, tokiai kaip titano tetrachloridas (žiūrėti, pavyzdžiui, K.Saigo and T.Mukaigama, Chemistry Letters, 1976, 769).

(V) formulės metilsililketenacetalai gali būti gauti iš (VI) formulės fenilacetalų, apdorojant baze ir trialkilsililhalogenidu, kurio formulė yra R_3SiCl arba R_3SiBr , tokiu kaip trimetilsililchloridas, arba baze (tokia kaip trietilaminas) ir trialkilsililtriflatu, kurio formulė yra $R_3Si-OSO_2CF_3$ (žiūrėti, pavyzdžiui, C.Ainsworth, F.Chen and U.Kio, J.Organometallic Chemistry, 1972, 46, 59).

Nevisada būtina išskirti tarpinius produktus (IV) ir (V);

LT 3730 B

atitinkamose sąlygose (I) formulės junginiai gali būti gauti iš (VI) formulės fenilacetatų "viename inde", nuosekliai pridėdant tinkamus reagentus, išvardintus aukščiau.

(VII) formulės fenilacetatai gaunami iš (VIII) formulės izochromanonų, apdorojant junginiu HX, kur X yra halogenas (toks kaip bromas), metanolyje. Ši transformacija gali būti atliekama dviem stadijomis, jei izochromanonas (VIII) apdirbamas junginiu HX nespirtiniame tirpiklyje, o gaunama fenilacto rūgštis paskui eterifikuojama standartiniais būdais (žiūrėti, pavyzdžiui, I. Matsumoto and I. Joshizawa, Jpn. Kokai (Tokki Koxo) 79 138 536, 1979 10 27, Chem. Abs., 1980, 92, 180829h; ir G.M.F. Lim, U.G. Reggon, R.D. Droghini, Res., Disel., 1979, 188, 672, Chem. Abs., 1980, 92, 128526t). (VIII) formulės izochromanonai gerai žinomi cheminėje literatūroje.

Alternatyviai (I) formulės junginiai gali būti gauti, paveikiant (XI) formulės ketoesterius metoksimetileninimo reagentais, tokiais kaip metoksimetilentrifenilfosforanas (žiūrėti, pavyzdžiui, W. Steglich, Gr. Schramm, T. Anke, T. Oberwinkler, EP 004448, 1980 07 04).

(IX) formulės ketoesteriai gali būti gauti iš (X) formulės ketoesterių, paveikiant anijonu bendros (III) formulės oksimus, kaip aprašyta aukščiau. Sudėtiniai (X) formulės ketoesteriai aprašyti EP 0331061.

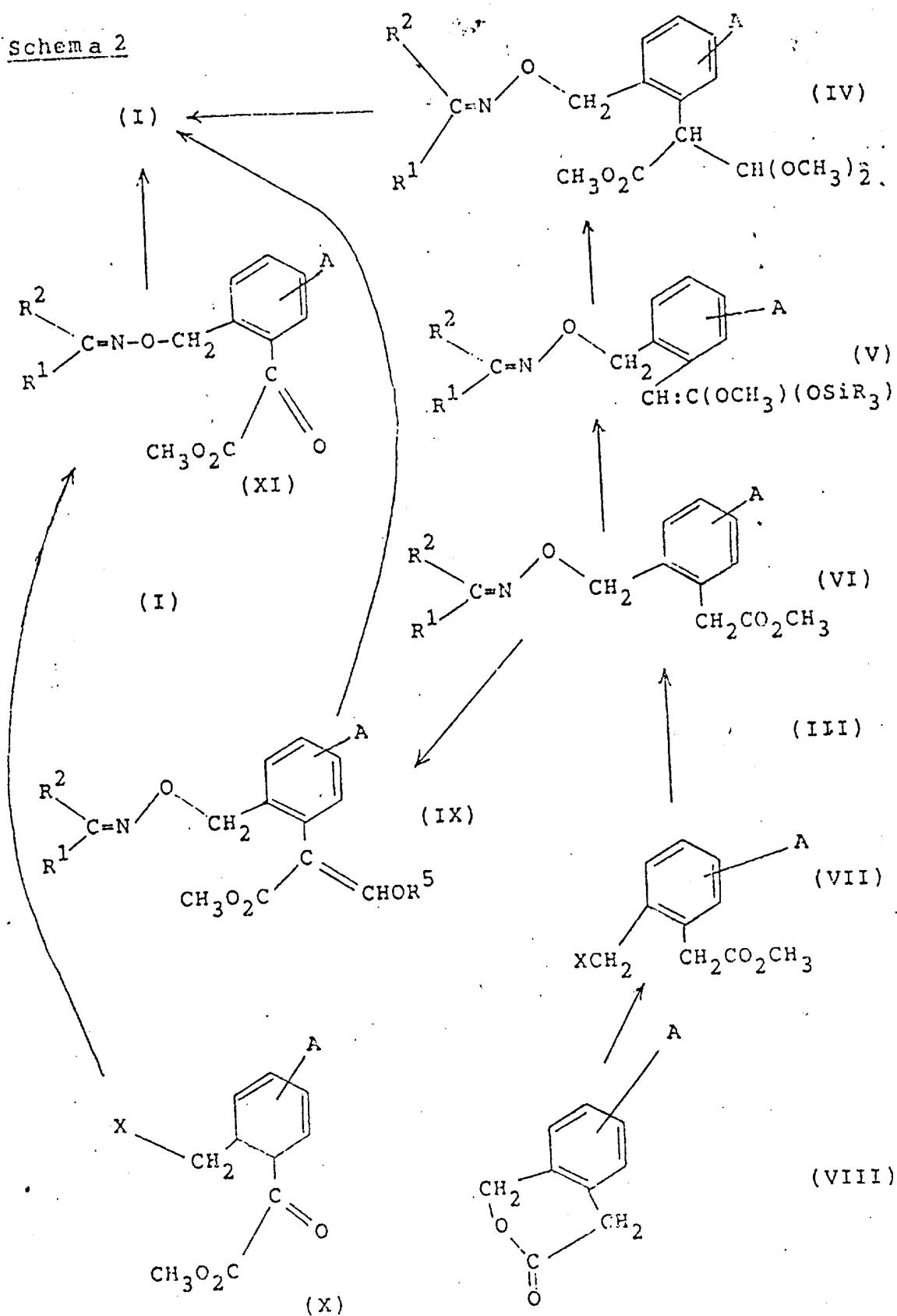
Išradimo junginiai yra aktyvūs fungicidai ir gali būti naudojami kovai su vienu ar daugiau iš šių patogeninių organizmų: ryžių *Pyricularia oryzae*, kviečių *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis* ir kitos rūdys, miežių *Puccinia hordei*, *Puccinia striiformis* ir kiti rūdžių pavidalai, kitų kultūrų, pavyzdžiui, kavamedžių, kriaušių, obelių, žemės riešutų ir dekoratyvinių augalų rūdys, miežių bei kviečių *Erysiphe graminis* (milte-

LT 3730 B

nis) ir kiti miltenio pavidalai įvairiose kultūrose, tokie kaip apynių *Sphaerotheca macularis*, agurkinių augalų (pavyzdžiui, agurkų) *Sphaerotheca fuliginea*, obelių *Podosphaera Zeucetricha* ir vynuogienojų *Uncinula necator*, grūdinių kultūrų *Helminthosporium* spp., *Phynosporium* spp., *Septoria* spp., *Pyrenophora* spp., *Pseudocercospora herpotrichoides* ir *Gaeumannomyces graminis*; žemės riešutų *Cercospora arachidicola* ir *Cercospora personata*, kiti *Cercospora* pavidalai kitose kultūrose, pavyzdžiui, cukriniuose runkeliuose, bananuose, sojos pupose ir ryžiuose; pomidorų, braškių, daržovių, vynuogių ir kitų kultūrų *Botrytis cinerea* (pilasis pelėsis). Daržovių (pavyzdžiui, agurkų), aliejinio rapso, obelių, pomidorų ir kitų kultūrų *Uromyces* spp.; obelių *Venturia inaequalis*, vynuogių *Plasmopara viticola*; kiti miltenio pavidalai, tokie kaip salotų *Bremia lactucae*, sojos pupų, tabako, svogūnų ir kitų kultūrų *Peronospora* spp.; apynių *Pseudoperonospora humuli* ir agurkų *Pseudoperonospora cubensis*, bulvių ir pomidorų *Phytophthora infestans* bei kiti *Phytophthora* spp. daržovėse, braškėse, avokado, pipiruose, dekoratyviniuose augaluose, tabake, kakavoje ir kitose kultūrose; ryžių *Thanaphorus cucumeris* ir kiti *Rhizostonia* pavidalai įvairiose kultūrose, tokiose kaip kviečiai ir miežiai, daržovės, medvilnė ir velėna.

Kai kurie iš junginių pasižymi plačiu aktyvumo spektru prieš grybelius *in vitro*. Jie taip pat gali parodyti aktyvumą prieš įvairius vaisių susirgimus po derliaus nuėmimo (pavyzdžiui, apelsinų *Penicillium digitatum* bei *italicum* ir *Trichoderma viride*, bananų *Gloeosporium musarium* ir greipfrutų *Botrytis cinerea*).

Schema 2



LT 3730 B

Be to, kai kurie iš junginių gali būti aktyvūs kaip sėklos beicas prieš *Fusarium* spp., *Septoria* spp., *Tilletia* spp. (kietoji kūlė, kviečių susirgimas, atsirandantis sėklose), *Ustilago* spp. ir *Helminthosporium* spp. grūdinėse kultūrose, *Phizostonia selani* medvilnėje ir *Pyricularia oryzae* ryžiuose.

Junginiai gali sistemingai judėti augaluose. Be to, šie junginiai gali būti pakankamai lakūs, kad būtų aktyvūs garavimo fazėje prieš grybelius augaluose.

Tuo būdu, šis išradimas pateikia kovos su grybeliais būdą, kuris numato junginio, apibrėžto aukščiau, arba kompozicijos, kurios sudėtyje yra šio junginio, fungicidiškai aktyvaus kiekio panaudojimą augalams, sėkloms arba augalų ir sėklų buvimui vietoms.

Kai kurie iš junginių pasižymi insekticidiniu aktyvumu ir gali būti naudojami kovai su daugeliu kenksmingų vabzdžių ir erkių, tinkamai parenkant naudojimo normas arba naudojimo laipsnius.

Todėl pagal dar vieną išradimo aspektą pateikiamas naikinimo arba kovos su vabzdžiais arba erkėmis būdas, į kurį įeina junginio, apibrėžto čia aukščiau, ar kompozicijos, kurios sudėtyje yra šio junginio, insekticidiškai arba miticidiškai efektyvaus kiekio panaudojimas vabzdžiams ar erkėms arba jų buvimo vietoms.

Junginiai gali būti panaudoti žemės ūkio tikslams betarpiškai, bet patogiau jie transformuojami į kompozicijas, panaudojant nešėjus arba skiediklius. Tuo būdu išradimas pateikia fungicidines ir miticidines kompozicijas, kurių sudėtyje yra junginių, čia aprašytų aukščiau, ir jiems tinkamo nešėjo arba skiediklio.

LT 3730 B

Junginiai gali būti naudojami įvairiais būdais. Pavyzdžiui, jie gali būti naudojami (transformuoti arba netransformuoti į paruoštą preparatų pavidalą) betarpiškai augalų lapams, sėkloms ir kitokiai terpei, kurioje išauga augalai, arba skirtiems pasodinimui augalams, arba jie gali būti naudojami apipurškimui ar apdulkinimui, arba gali būti naudojami preparatų pavidalo kaip kremas ar pasta, arba jie gali būti naudojami garų ar granulių, lėtai atpalaiduojančių aktyvųjį ingredientą, pavidalo.

Naudoti galima bet kuriai augalo daliai, įskaitant lapiją, stiebus, šakas arba šaknis, dirvožemiui apie šaknis, sėkloms prieš jų sėjimą, dirvožemiui apskritai, laistomam vandeniui arba hidroponinės kultūros sistemai. Išradimo junginiai taip pat gali būti įšvirkščiami į augalus arba purškiami ant augmenijos, naudojant elektrodinaminius purškimo įrenginius arba panaudojant kitus mažų tūrių būdus.

Čia naudojamas terminas "augalai" apima sodinukus, krūmus ir medžius. Be to, fungicidinis išradimo būdas numato apsauginį, profilaktinį ir gydomąjį apdorojimą.

Geriausieji junginiai naudojami žemės ūkio ir sodų tikslams kompozicijų pavidalo. Naudojamos kompozicijos tipas bet kuriuo atveju priklauso nuo konkretaus tikslo, kuriam ši kompozicija naudojama.

Kompozicijos gali būti kaip dulkinami milteliai arba granulės, kurių sudėtyje yra aktyvus ingredientas (išradimo junginys) ir kietas skiediklis arba nešėjas, pavyzdžiui, tinka užpildai, tokie kaip kaolinas, bentonitas, infuzorinė žemė, dolomitas, kalcio karbonatas, talkas, miltelių pavidalo magnезija (magnio oksidas), fullerio žemė, gipsas, diatomitas ir kinietiškas molis. Tokios granulės gali būti iš anksto suformuotos kaip

LT 3730 B

tinkamos naudoti dirvai be papildomo apdirbimo. Šios granulės gali būti gaminamos arba impregnuojant užpildo tabletes aktyviu ingredientu, arba darant tabletes iš aktyvaus ingrediento ir miltelių pavidalo užpildo mišinio. Į kompozicijas, skirtas sėklų beicavimui, gali įeiti medžiaga (pavyzdžiui, mineralinis aliejus), kuri palengvina kompozicijos adheziją su sėklomis; alternatyviai aktyvus ingredientas gali būti pagamintas kaip preparatas, skirtas sėklų beicavimui, panaudojant organinį skiediklį (pavyzdžiui, N-metilpirolidiną, propilenglikolį arba dimetilformamidą). Kompozicijos gali būti taip pat drėkinamų miltelių arba vandenyje disperguojamų granulių pavidalo, įjungiant drėkinančią arba disperguojančią medžiagą dispergavimo skysčiuose palengvinimui. Milteliuose ir granulėse taip pat gali būti suspenduojamųjų medžiagų.

Emulguojami koncentratai arba emulsijos gali būti gaminami, ištirpinant aktyvų ingredientą organiniame tirpiklyje, paprastai turinčiame drėkinančios medžiagos, o paskui sudedant mišinį į vandenį, taip pat turintį drėkinančios arba emulguojančios medžiagos. Tinkami organiniai tirpikliai yra aromatiniai tirpikliai, tokie kaip alkilbenzoliai ir alkilnaftalinai; ketonai, tokie kaip izoforonas, cikloheksanonas ir metilcikloheksanonas; chlorinti angliavandeniliai, tokie kaip chlorbenzolas ir trichlorešanas; ir alkoholiai, tokie kaip benzolo alkoholis, furfurilo alkoholis, butanolis ir paprasti glikolio eteriai.

Suspensiniai stambių netirpių kietų medžiagų koncentratai gali būti gaminami, susmulkinant rutuliniame malūne arba granuliavimo malūne su disperguojančia arba suspenduojančia medžiaga, kuri įjungiama, kad kieta medžiaga nenusėstų (nesusigulėtų).

LT 3730 B

Kompozicijos, naudojamos purškimui, gali būti aerosolių pavidalo, kuriuose preparato forma yra konteineryje propelento (reagento), pavyzdžiui, fluortrichlormetano arba dichlor - difluormetano, slėgyje.

Išradimo junginiai gali būti sumaišyti sausi su pirotechniniu mišiniu, kad sudarytų kompoziciją, tinkančią dūmų, turinčių junginių, generavimui uždarose erdvėse.

Alternatyviai junginiai gali būti naudojami mikrokapsulių pavidalo. Jie taip pat gali būti gaminami biosuskaidomuose polimeriniuose apvalkaluose, kad būtų gautas lėtas, reguliuojamas aktyvios medžiagos atpalaidavimas.

Įjungiant tinkamus priedus, pavyzdžiui, priedus pasiskirstymo pagerinimui, adhezyvios jėgos ir atsparumo lietu ant apdorojamų paviršių padidinimui, įvairios kompozicijos geriau pri - taikomos prie įvairių naudojimo sričių.

Išradimo junginiai gali būti naudojami mišinių su trąšomis pavidalo (pavyzdžiui, su azoto, kalio arba fosforo turinčiomis trąšomis). Kompozicijos, apimančios tik trąšų granules, kurių sudėtyje yra junginių, pavyzdžiui, apvalkalo pavidalo, yra tinkamesnės. Tokios granulės tinkamai turi būti 25 svorio % junginio . Tuo būdu išradimas taip pat pateikia trąšų kompozicijas, į ku - rias įeina trąša ir (I) bendros formulės junginys arba jo druska ar metalų kompleksas.

Drėkstantys milteliai, emulguojami koncentratai ir suspensiniai koncentratai paprastai turi savyje paviršiaus aktyvią medžiagą, pavyzdžiui, drėkstantys medžiagas, dispergentus, emulgatorius arba suspenduojančias medžiagas. Šios medžiagos gali būti katijoninės, anijoninės arba nejoninės.

Tinkamos katijoninės medžiagos yra ketvirtiniai amonio jun -

LT 3730 B

giniai, pavyzdžiui, cetiltrimetilamonio bromidas. Tinkamos organinės medžiagos yra muilai, sieros rūgšties alifatinių sudėtinųjų monoeterių druskos (pavyzdžiui, natrio laurilsulfatas); sulfuruotų aromatinių junginių druskos (pavyzdžiui, natrio decilbenzosulfonatas,, natrio, kalcio arba amonio lignosulfonatas, natrio diizopropilo ir triizopropilo naftalinsulfonatų mišinys).

Tinkamos nejoninės medžiagos yra etilo oksido kondensacijos su riebiaisiais alkoholiais, tokiais kaip oleilo arba cetilo alkoholis, arba su alkilfenoliais, tokiais kaip oktil arba jonilfenolis arba oktilkrezolis. Kiti nejoniniai agentai yra daliniai sudėtiniai eteriai, kurie yra riebiųjų rūgščių su ilga grandine ir heksitolanhidridų dariniai, nurodytų dalinių sudėtinųjų eterių kondensacijos su etileno oksidu produktai, ir lecitinai.

Tinkamos suspenduojančios medžiagos yra hidrofiliniai koldaidai (pavyzdžiui, polivinilpirolidonas ir natrio karboksimetilceliuliozė, ir brinkstantys moliai, tokie kaip bentonitas arba atapulgitas.

Kompozicijos, naudojamos kaip vandeninės dispersijos arba emulsijos, tiekiamos koncentrato, kuriame yra didelis aktyvaus ingrediento kiekis, pavidalo, ir šis koncentratas prieš naudojimą atskiedžiamas. Geriau, kai šie koncentratai gali būti laikomi ilgą laiką, o po to gali būti atskiedžiami vandeniu, taip gaunant vandeninius preparatus, kurie išlieka homogeniškai pakankamai ilgą laiką ir gali būti naudojami apipurškiant arba apdulkinant įprastais prietaisais.

Koncentratuose gali būti iki 95%, geriau 10-85%, pavyzdžiui, 25-60 svorio % aktyvaus ingrediento. Atskiedžiant vandeninių preparatų gavimui, vandeniniuose preparatuose gali būti kintan-

LT 3730 B

tis aktyvaus ingrediento kiekis, kuris priklauso nuo naudojimo tikslo, bet gali būti naudojami vandeniniai preparatai, kuriuose yra 0,0005 arba 0,01-10 svorio % aktyvaus ingrediento.

Šio išradimo kompozicijose gali būti kitų junginių, pasižyminčių biologiniu aktyvumu, pavyzdžiui, junginių, pasižyminčių analogišku arba komplementariu fungicidiniu aktyvumu, arba pasižyminčių augalų augimo reguliaciniu, herbicidiniu ir insekticidiniu aktyvumu.

Fungicidinis junginys, kuris gali būti išradimo kompozicijos sudėtyje, gali būti junginys, kuris sugeba slopinti varpinių augalų (pavyzdžiui, kviečių) varpų ligas, tokias kaip Septoria, Gibberella ir Helminthosporium Spp. sėklos susirgimus, be to, susirgimus, atsirandančius dirvoje ir netikrąją miltligę, ir tikrąją miltligę vynuogėse, miltligę ir rauples obalyse ir kt.

Įjungus dar vieną fungicidą, kompozicijos aktyvumo aspektas gali būti platesnis, negu vieno (I) bendros formulės junginio. Be to, kitas fungicidas gali parodyti sinergetinį poveikį fungicidiniui (I) bendros formulės junginio aktyvumui. Fungicidinių junginių, kurie gali būti įjungiami į išradimo kompozicijas, pavyzdžiai yra (±)-2-(2,4-dichlorfenil)-3-(1N-1,2,4-triazol-1-il)propilo 1,1,2,2-tetrafluoretilo eteris, (RS)-1-amino-propilfosfino rūgštis, (RS)-4-(4-chlorfenil)-2-fenil-2-(1H-1H,1,2,4-triazol-1-ilmetil)butironitrilas, (RS)-4-chlor-N-(ciano/etoksi/metil)-benzamidai, (Z)-N-but-2-eniloksimetil-2-chlor-2',6'-diethylacetanilidas, 1-(2-ciano-2-metoksiiminoacetil)-3-etilo karbamidas, 1-(2RS, 4RS; 2RS, 4RS)-4-bro-2-(2,4-dichlorfenil(tetrahidrofurfuril)-1N-1,2,4-triazolas, 3-(2,4-dichlorfenil)-2-(1N-1,2,4-triazol-1-il(chinazolin-4(3H)-onas, 3-chlor-4-(4-metil-1,2-(1H-1,2,4-triazol-1-metil)-1,3-dioksolan-2-il)fenil-4-chlorfenilo eteris, 4-brom-2-ciano-N,N-dimetil-6-trifluormetilbenzi-

LT 3730 B

midazol-1-sulfonamidas, 4-chlorbenzil-N-(2,4-dichlorfenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il(tioacetamid,5-etil-5,8-dihidro-8-okso(1,3)-dioksolo(4,5-g)chinolin-7-anglies rūgštis, α -(N-(3-chlor-2,6-ksilil)-2-metoksiacetamido)- β -butirolaktonas, anilazinas, BAS 454, benalaksilas, benomilas, biloksazolis, biñapakrilas, bi-terganolis, blasticidinas, bupirimatas, butiobatas, kaptafolas, kaptanas, karbondazimas, karboksinas, chlorbenzotiazonas, chloronebas, chlorotalonilas, chlorozolinatas, vario turintys junginiai, tokie kaip vario chloroksidas, vario sulfatas ir Bordo mišinys, cikloheksimidai, cimoksanilas, ciprokonolas, ciprofuramas, di-2-piridilo disulfido 1,1'-dioksidas, dichlofluanidas, dichlonas, diklobutrazolis, diklomezinas, dikloranas, dimetamorfai, dimetirimolas, dinikanazolas, dinokapas, ditalimfosai, ditanonas, dodemorfai, dodinas, edifenfosai, etakonazolas, etirimolas, etilo (Z)-N-benzil-N-([metil-(metiltioetilidenamino-oksikarbonil)amino]tio)- β -alaninatas, etridazolas, fenapanilas, fenarimolas, fenfuramas, fenpiklonilas, fenpropidinas, fenpropimorfai, fentin-acetatas, fentin-hidroksidas, flutolaninas, flutriafolai, fluzilazolas, folpetas, fosetilaliuminis, fuberidazolas, furalaksilas, furkonazolas-cis, guazatinas, heksakonazolas, hidroksiizoksazolas, imazalilas, iprobenfosai, iprodionas, izoprotiolanas, kasugamicinas, mankocebas, manebas, mopronilas, metalaksilas, metfluroksamas, metsulfovaksai, miklobutanilas, neoazocinas, nikelio dimetilditiokarbamatas, nitrotal-izopropilas, puarimolio ofurakas, gyvsidabrio-organiniai junginiai, oksadiksilas, oksikarboksinas, penkonazolas, pencikuronas, pent-4-enilo N-furfuril-N-imidazol-1-ilkarbonil-DL-homoalaninatas, fenazino oksidas, ftalidas, poliksinas-D, poliramas, probenazolas, prochlorazai, procimidonas, propamokarbas, propikonazolas, propinobas, protiokarbas, pirazofosai, pirifenoksai, piroksilonas, piroksifuras, pirolnitrinas, chinometionatas, chinto -

zenas, streptomycinas, siera, techloftalamas, teknazenas, tebukonazolas, tiabendazolas, tiofanat-metilas, tiramas, tolklofosmetilas, triacetatinė druska 1,1-iminodi(oktametilen)diguanidinas, triadimefonas, triadimenolas, triazbutilas, triciklazolas, tridemorfos, triforinas, validamicinas A, vinklozolidas ir cinebas. (I) bendros formulės junginiai gali būti sumaišyti su dirvožemiu, durpėmis arba kitomis terpėmis šaknų sistemai, norint apsaugoti augalus nuo sėklų, dirvožemio arba lapijos grybelinių susirgimų.

Tinkami insekticidai, kurie gali būti įjungti į išradimo kompoziciją, apima buprofeziną, karbarilą, karbofuraną, karbo-sulfaną, chlorpirifosą, cikloprotriną, demeton-S-metilą, diazinoną, dimetoatą, etofenproksą, fenitrotioną, fenobukarbą, fenitroną, formotioną, izoprokarbą, izoksationą, monokrotofosą, fen-toatą, pirimikarbą, propafosą ir XMC.

Junginiai, reguliuojantys augalų augimą, yra junginiai, kurie slopina piktžolių ir Eeopeao susidarymą arba selektyviai slopina mažiau pageidaujamų augalų (pavyzdžiui, žolių) augimą.

Junginių, reguliuojančių augalų augimą ir tinkančių naudojimui su šio išradimo junginiais, pavyzdžiai yra 3,6-dichlorpikolino rūgštis, 1-(4-chlorfenil)-4,6-dimetil-2-okso-1,2-dihidropiridin-3-anglies rūgštis, metil-3,6-dichloranizatas, abscizo rūgštis, azulamas, benzoilprop-etilas, karbetamidas, daminozidas, difenzokvatas, dikegulakas, etefonas, fenpentezolas, fluoridamidas, glifozatas, glifozinas, hidroksibenzonitrilai (pavyzdžiui, bromoksinilas), inabenfidas, izopirimolas, riebieji alkoholiai ir rūgštys su ilga grandine, maleino hidrozas, mefluididas, morfaktinai (pavyzdžiui, chlorfluorekolas), paklobutrazolas, fenoksiacto rūgštys (pavyzdžiui, 2,4-D arba MCPA), pakeista benzoinė rūgštis (pavyzdžiui, trijodbenzoinė rūgštis),

LT 3730 B

pakeisti ketvirtiniai amonio ir fosfino janginiai (pavyzdžiui, chloromekvatchlorfonis arba mepikvatfluoridas), teknazenas, auksinai (pavyzdžiui, indolacto rūgštis, indolsviesto rūgštis arba naftoksiacto rūgštis), citokininai (pavyzdžiui, benzimidazolas, benziladeninas, benzilaminopurinas, difenilkarbamidas arba kinetinas), hiperrelinai (pavyzdžiui, GA_3 , GA_4 arba GA_7) ir tripentenolis.

Toliau pateikiami pavyzdžiai iliustruoja išradimą. Visuose pavyzdžiuose terminas "paprastas eteris arba eteris" reiškia dietilo eterį, magnio sulfatas buvo naudojamas tirpalų džiovimui ir tirpalai buvo koncentruojami sumažintame slėgyje. Reakcijos, kuriose dalyvauja tarpiniai produktai, jautrūs orui ir vandeniui, buvo vykdomos azoto atmosferoje, o tirpikliai prieš naudojimą buvo džiovinami, kai to reikėjo. Jei nenurodyta kitaip, chromatografija buvo atliekama kolonėlėje, naudojant silikagelį kaip stacionarią fazę. Kai nurodomi, IR spektro ir BMR duomenys yra selektyvūs: nebandoma išvardinti kiekvieną absorbciją visais atvejais. 1H BMR spektrai buvo rašomi, naudojant $CDCl_3$ tirpalus, jei nenurodyta kitaip. Tekste naudojami tokie sutrumpinimai:

THF = tetrahidrofuranas

DMF = N,N-dimetilformamidas

BMR = branduolių magnetinis rezonansas

IR = infra-raudonasis

lyd.t. = lydymosi temperatūra

DESC = didelio efektyvumo skystinė chromatografija

s = singletas

d = dubletas

t = tripletas

m = multipletas

1 PAVYZDYS

Šis pavyzdys iliustruoja (E),(E)-metil-3-metoksi-2-[2-(3-metilbenzaldoksiminometil)fenil] propenoato gavimą (1 Lentelės 5 junginys).

(E)-3-metilbenzaldoksimo (0,23 g) tirpalas DMF (5 ml) buvo lašinamas į maišomą natrio hidrido (0,051 g) suspensiją DMF (5 ml) kambario temperatūroje. Po 0,5 valandos į reakcijos mišinį buvo pridėta (E)-metilo 2-(2-bromometil)fenil)-3-metoksipropenoato (0,5 g), gauto būdu, aprašytu EP-A-0203606, tirpalo DMF (5 ml), ir gautas mišinys buvo maišomas kambario temperatūroje 4 valandas. Mišinys buvo išpiltas į vandenį ir du kart ekstrahuotas eteriu. Sujungti ekstraktai buvo perplauti vandeniu, tada buvo džiovinami, koncentruojami ir chromatografuojami, naudojant etėrį kaip eliuentą, taip gaunant pageidaujamą junginį (0,132 g, 23% išeiga) kaip blyškiai geltoną aliejų.

IR maksimumas (plėvelė): 1709, 1631 cm^{-1}

^1H BMR (270 MHz) δ : 2,35 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,80 (3H, s),
5,12 (2H, s), 7,1-7,55 (8H, m), 7,59 (1H, s),
8.05 (1H, s) m.d.

2 PAVYZDYS

Šis pavyzdys iliustruoja metilo 2-[2-(3,5-dimetilpirazin-2-il-acetoksiminometil)fenil]-3-metoksipropenoato (E),(E) ir (Z), (E) mišinio gavimą (1 Lentelės 176 junginys).

Į 2,6-dimetilpirazolo (3,24 g), sieros rūgšties (15 ml 3,4M tirpalo) ir acetaldehido (10 ml) mišinį, maišomą 0°C temperatūroje, tuo pačiu metu buvo pridėta geležies (II) sulfato tirpalo (50,1 g 150-tyje ml vandens) ir tret-butilhidropenoksido (16,2 ml 70% vandeninio tirpalo). Temperatūra pridėjimo metu

LT 3730 B

buvo palaikoma žemiau 3°C . Pabaigus pridėjimą reakcijos mišinys buvo maišomas 0°C temperatūroje 1 valandą. Natrio metabi-sulfatas buvo dedamas iki tol, kol mišinys nedavė neigiamo krakmolo-jodo bandymo rezultato. Reakcijos mišinys buvo ekstrahuojamas dichlormetamu, apjungti ekstraktai buvo perplauti vandeniu, paskui džiovinami, koncentruojami ir chromatografuojami, naudojant eterio ir $60-80^{\circ}\text{C}$ benzino mišinį (4:1) kaip eliuentą, taip gaunant 2-acetil-3,5-dimetilpiraziną (2,65 g, 59% išeiga) kaip blyškiai geltoną aliejų.

IR maksimumas (plėvelė) : 1694, 1551, 1262, 1175 cm^{-1} .

^1H BMR (270 MHz) δ : 2,62 (3H, s), 2,70 (3H, s), 2,80 (3H, s),
8,36 (1H, s) m.d.

2-Acetil-3,5-dimetilpirazinas (2,65 g), hidroksilamino chlorhidratas (2,5 g) ir natrio acetato trihidratas (3,5 g) buvo šildomi su grįžtamu šaldytuvu metanolyje (50 ml) 1 valandą. Reakcijos mišinys buvo koncentruotas, atskiestas vandeniu (75 ml) ir ekstrahuotas etilacetatu. Sujungti ekstraktai buvo džiovinami ir koncentruojami, gaunant aliejų, kuris buvo ištrintas su eteriu ir $60-80^{\circ}\text{C}$ benzinu, taip gaunant 3,5-dimetil-2-(1-hidroksiminoetil)piraziną (2,54 g, 87 % išeiga) kaip baltą kietą medžiagą (lyd. t. $85-89^{\circ}\text{C}$) 1:1 (E/Z) izomerų pavidalo.

IR maksimumas (plėvelė): 2925, 1465, 1376, 1086, 930 cm^{-1} .

^1H BMR (270 MHz) δ : 2,23 (3H, s), 2,33 (3H, s), 2,53 (3H, s), 2,56
2,56 (3H, s), 2,58 (3H, s), 2,68 (3H, s),
8,32 (1H, s), 8,35 (1H, s), 9,45 (1H, pl.s),
m.d.

1:1 mišinys (E/Z)-3,5-dimetil-2-(1-hidroksiminoetil)pirazino (0,87 g) buvo dalimis dedamas į maišomą natrio hidrido (0.25 g) suspensiją DMF (20 ml) maždaug 5°C temperatūroje. Po

1 valandos į reakcijos mišinį 0°C temperatūroje buvo pridėta (E)-metil-2-[2-(bromometil)-fenil]-3-metoksipropenoato (1,5 g) tirpalo DMF (5 ml). Po 1,5 valandos mišinys buvo išpiltas į vandenį ir dukart ekstrahuotas eteriu. Sujungti ekstraktai buvo perplauti druskos tirpalu, tada išdžiovinti, koncentruoti ir chromatografuoti, panaudojant eterio:heksano 1:1 mišinį kaip eliuentą, taip gaunant pageidaujamą junginį, oksimo izomerų mišinį (pagrindinis:antraeilis 7:3) kaip blyškiai rausvą kietą medžiagą (0,57 g, 30 % išeiga), lyd.t. $56-60^{\circ}\text{C}$.

IR maksimumas (plėvelė): 1707, 1624, 1132 cm^{-1} .

^1H BMR (270 MHz) pagrindinis izomeras- δ : 2,39 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,57 (3H, s), 3,67 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,15 (2H, s), 7,1-7,9 (4H, m), 7,59 (1H, s), 8,27 (1H, s) m.d.
Anrtaeilis izomeras- δ : 2,22 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,57 (3H, s), 3,67 (3H, s), 3,82 (3H, s), 5,27 (2H, s), 7,1-7,9 (4H, m), 7,76 (1H, s), 8,33 (1H, s) m.d.

3 PAVYZDYS

Šis pavyzdys iliustruoja (E), (E)-metil-3-metoksi-2-[2-(feniloacettoksiminometil)fenil]propenoato gavimą (1 Lentelės 23 junginys).

Acetofenono-oksimo tirpalas (1,23 g) DMF (5 ml) buvo lašinamas į maišomą natrio hidrido (0,367 g) suspensiją DMF (25 ml). Po 1 valandos į reakcijos mišinį buvo pridėta (E)-metilo 2-[2-(brommetil)fenil]-3-metoksipropenoato (2,0 g) tirpalo DMF (15 ml), ir gautas mišinys buvo maišomas kambario temperatūroje 16 valandų. Mišinys buvo išpiltas į vandenį ir du kartus ekstrahuojamas eteriu. Sujungti ekstraktai buvo perplauti vandeniu,

paskui buvo džiovinama, koncentruojami ir chromatografuojami, naudojant eterio: 40-60 naftos 3:2 mišinius, gaunant nevalytą aliejų. Po DESC, naudojant eterio: 40-60 naftos 1:1 mišinius gautas pageidaujamas junginys (0,55 g, 23 % išeiga) kaip blyškiai geltonas aliejus.

IR maksimumas (plėvelė): 1703, 1631 cm^{-1} .

^1H BMR pateiktas 2 Lentelėje.

4 PAVYZDYS

Šis pavyzdys iliustruoja (E),(E)- ir (Z),(E)-izomerų metilo 3-metoksi-2-[2-[(pirimidin-5-ilizopropiloksimino)-0-metil]fenil]propenoato gavimą ir išskaidymą (1 Lentelės 66 ir 67 junginys).

Oksimo izopropilpirimidin-5-il-ketono (0,29 g 3:2 (E)-:(Z)-izomerų mišinio) tirpalas DMF (5 ml) buvo pridėtas į maišomą natrio hidrato (0,09 g) suspensiją DMF (10 ml). Po 2 valandų mišinys buvo atšaldytas iki 0°C , ir į jį buvo pridėta (E)-metilo 2-(2-(brommetil(fenil)-3-metoksipropenoato (0,5 g) tirpalo DMF (5 ml), ir mišinys buvo maišomas 3 valandas. Mišinys buvo išpiltas į vandenį ir ekstrahuotas eteriu. Sujungti ekstraktai buvo perplauti vandeniu, išdžiovinti ir koncentruoti, gaunant aliejų, nevalytą (E), (E)- ir (Z),(E)-izomerų mišinį. Šių izomerų išskaidymui į du jų komponentus buvo naudojama DESC, naudojant eterį kaip eliuentą:

1. Greičiau išplaunama (eliucija) frakcija - (Z)-oksimo eteris, (E)-propenoatas (0,115 g, 18 % išeiga). Skaidrus aliejus. (1 Lentelės 67 junginys).
2. Lėčiau išplaunama (eliucija) frakcija - (E)-oksimo eteris, (E)-propenoatas (0,098 g, 15 % išeiga). Skaidrus aliejus

(1 Lentelės 66 junginys).

^1H BMR pateiktas 2 Lentelėje.

5 PAVYZDYS

Šis pavyzdys iliustruoja vieno stereoizomero metilo 2-[2-fenil(metiltio)oksiminometil]fenil]-3-metoksi-propenoato gavi - mą (1 Lentelės 191 junginys).

Chloro (1,5 g) tirpalas anglies tetrachloride (42 ml) porcijomis buvo pridėtas į maišomą dalinį benzaldehydoksimo (2,5 g; ^1H BMR: 8,18 (1H, s), 9,40 (1H, pl.s.) m.d.) tirpalą anglies tetrachloride (20 ml) kambario temperatūroje. Po to reakcijos mišinys buvo maišomas kambario temperatūroje 3 valandas, tada išpiltas į vandenį. Organinis sluoksnis buvo atskirtas, išdžiovintas ir koncentruotas, gaunant beveik gryną geltono skysčio pavidalo α -chlorbenzaldehyd-oksimą (3,2 g). Į maišomą atšaldytą ledų dalies šio α -chlorbenzaldehyd-oksimo (1,5 g) tirpalą metanolyje (15 ml) buvo įlašinta natrio metantolato (0,68g) tirpalo metanolyje (15 ml). Pabaigus lašinimą reakcijos mišinys buvo maišomas dvi valandas, pastoviai šaldant lediniame vandenyje. Metanolis buvo pašalintas sumažintame slėgyje, o likutis buvo chromatografuojamas, naudojant dichlormetaną kaip eliuentą, gaunant vienintelį stereoizomerą α -metiltiobenzaldehyd-oksimą (0,670 g, 42 % išeiga) kaip baltą kristalinę kietą medžiagą, lyd. t. 76 - 78°C

^1H BMR: δ 2,08 (3H, s), 9,12 (1H, s) m.d.

α -metiltiobenzaldehyd-oksimo (0,575 g) tirpalas DMF (10 ml) buvo įlašintas į maišomą natrio hidrido (85 g) suspensiją DMF (15 ml) kambario temperatūroje. Po valandos buvo įlašinta (E)-metilo 2-[2-(brommetil)fenil]-3-metoksipropenoato

(0,99 g) tirpalo DMF, ir praėjus dar 3 valandoms mišinys buvo išpiltas į vandenį ir ekstrahuotas etilacetatu. Organiniai ekstraktai buvo praplauti vandeniu, išdžiovinti, koncentruoti ir chromatografuoti, naudojant didėjančią etilacetato kiekį heksane kaip eliuentą, taip gaunant pageidaujamą junginį (1,05 g, 83 %) kaip bespalvį aliejų,

IR: 1706 cm^{-1} .

^1H BMR pateiktas 2 Lentelėje.

6 PAVYZDYS

Šis pavyzdys iliustruoja vienintelių stereoizomerų metilo 2-[2-[fenil(metilsulfinil)oksiminometil]fenil]-3-metoksipropenoato ir metilo 2-(2-(fenil(metilsulfonil)oksiminometil)fenil)-3-metoksi-propenoato (1 Lentelės 227 ir 228 junginiai) gavimą.

m-Chlornadbenzoinė rūgštis (0,25 g, turinti 45 % m-chlorbenzoinės rūgšties) porcijomis per 30 minučių buvo pridėta į maišomą metilo 2-[2-[fenil(metiltio)oksiminometil]fenil]-3-metoksipropenoato (0,30 g, gauto kaip aprašyta 5 pavyzdyje), atšaldyto lediniame vandenyje, tirpalą dichlormetane (20 ml). Dar po 15 minučių reakcijos mišinys buvo praplautas iš eilės vandeniniu natrio bikarbonato tirpalu ir vandeniu, po to išdžiovintas, koncentruotas ir chromatografuotas, panaudojant 1:1 etilacetato ir heksano mišinį kaip eliuentą, taip gaunant pageidaujamus junginius: (1) sulfoną, išplaunama (eliucija) pirma, dervos pavidalo (0,09 g, 28% išeiga); (2) sulfoksidą, taip pat dervos pavidalo (0,15 g, 48% išeiga).

^1H BMR pateiktas 12 Lentelėje.

7 PAVYZDYS

Šis pavyzdys iliustruoja dviejų metilo 2-[2-(fenil(metoksi)oksiiminometil]fenil]-3-metoksipropenoato stereoizomerų gavimą (I Lentelės 225 ir 226 junginiai).

α -metoksibenzaldehido-oksimo stereoizomerų mišinys buvo gaunamas dviem stadijomis iš metilbenzoato, apdirbant iš eilės Lawesson reagentu ir hidroksiliniu (žiūrėti, pavyzdžiui, EP 0299382). Stereoizomerai buvo atskirti chromatografiniu būdu, panaudojant dichlormetaną kaip eliuentą:

(1) Izomeras A, išplaunamas (eliucija) pirmas, blyškiai geltona kieta medžiaga, lyd. t. 55 - 57°C, ^1H BMR: 3,83 (3H, s), 7,72 (1H, s) m.d.

(2) Izomeras B, bespalvė derva,

^1H BMR: δ 3,96 (3H, s), 8,84 (1H, s) m.d.

Šie du stereoizomeriniai oksimai atskirai paverčiami pageidaujamais junginiais būdu, aprašytu 5 pavyzdyje, t. y. nuosekliai apdirbant natrio hidridu ir (E)-metilo 2-[2-(brommetil)fenil]-3-metoksipropenoatu. Iš izomero A gautas pageidaujamas dervos pavidalo 1 Lentelės 225 junginys, o iš izomero B gautas pageidaujamas 1 Lentelės 226 junginys, taip pat dervos pavidalo (sakai).

^1H BMR pateiktas 2 Lentelėje

Žemiau pateikti kompozicijų, tinkamų žemės ūkyje ir sodininkystėje ir gaunamų iš šio išradimo junginių, pavyzdžiai. Šios kompozicijos sudaro dar vieną išradimo aspektą. Procentai reiškia svorio procentus.

8 PAVYZDYS

Emulguojamas koncentratas gaminamas sudedant ir maišant ingredientus, kol jie ištirpsta.

1 Lentelės 45 junginys	10%
Benzilo alkoholis	30%
Kalcio dodecilbenzolsulfonatas	5%
Nonilfenoletoksilatas (13 mol etileno oksido)	10%
Alkilbenzoliai	45%

9 PAVYZDYS

Aktyvus ingredientas ištirpinamas metilendichloride, o gautu skysčiu apipurškiamos granulės iš atapulgito molio. Skiedikliui leidžiama išgaruoti, taip gaunant granulių pavidalo kompoziciją.

1 Lentelės 45 junginys	5%
Atapulgito granulės	95%

10 PAVYZDYS

Kompozicija, tinkanti naudoti sėklų beicavimui, gaunama susmulkinant ir sumaišant tris ingredientus.

1 Lentelės 45 junginys	50%
Mineralinis aliejus	2%
Kinietiškas molis	48%

11 PAVYZDYS

Dulkinami milteliai gaunami, susmulkinant ir sumaišant aktyvųjį ingredientą su talku.

1 Lentelės 45 junginys	5%
Talkas	95%

12 PAVYZDYS

Suspensinis koncentratas gaunamas, susmulkinant ingredientus rutuliniame malūne, sudarant vandeningą susmulkinto mišinio emulsiją su vandeniu.

1 Lentelės 45 junginys	40%
Natrio lignosulfonatas	10%
Bentonitinis molis	1%
Vanduo	49%

Ši preparatyvinė forma gali būti naudojama purškimui, atskiedžiant vandeniu arba gali betarpiškai būti naudojama sėkloms.

13 PAVYZDYS

Preparatyvinė forma kaip drėkinami milteliai gaunama maišant kartu susmulkintus ingredientus, kol jie tolygiai persimaišo.

1 Lentelės 45 junginys	25%
Natrio laurilsulfatas	2%
Natrio lignosulfonatas	5%
Silicio dioksidas	25%
Kinietiškas molis	43%

14 PAVYZDYS

Buvo tiriamas junginių aktyvumas prieš įvairius augalų lapų grybelinius susirgimus. Buvo naudojamas toks būdas.

Augalai buvo auginami komposte puodeliams John Innes (Nr. 1 arba 2) mini puodeliuose, kurių diametras 4 cm. Tiriami junginiai buvo paruošti naudojimui preparatyvinės formos arba susmulkinti, naudojant granuliatorių su vandeniniu Disperzoliu T, arba kaip tirpalas acetone ar mišinyje acetonas/etanolis, kuris

LT 3730 B

buvo atskiestas iki reikiamos koncentracijos betarpiškai prieš vartojimą. Sergant lapijai, preparatyvinės formos (100 dalių/mil. aktyvaus ingrediento) buvo išpurkštos ant lapų arba panaudotos, apdorojant augalų šaknis dirvožemyje.

Preparatai purškimui buvo naudojami maksimaliam išlaikymui paviršiuje ir šaknų sudrėkinimo iki galutinės koncentracijos, ekvivalentiškos maždaug 40 dalių/mil. aktyvaus ingrediento sausame dirvožemyje. Kai buvo purškiami varpiniai augalai, buvo pridedama Tween 20, kad galutinė koncentracija būtų 0,05%.

Daugeliui bandymų junginys buvo panaudotas apdoroti dirvą (šaknis) ir lapiją (apipurškiant) vieną ar dvi dienas prieš inokuliuojant susirgimą. Išimtis buvo bandymas su Erysiphe graminis, kuriame augalai buvo inokuliuoti 24 valandos prieš apdorojimą. Lapų patogeniniai organizmai buvo panaudoti, apipurškiant sporų suspensijomis tiriamų augalų lapus. Po inokuliacijos augalai buvo patalpinami į atitinkamą aplinką tam, kad infekcija galėtų vystytis, o po to inkubuojami tol, kol susirgimas buvo tinkamas įvertinimui. Laiko tarpas tarp inokuliacijos ir įvertinimo keitėsi nuo 4 iki 14 dienų, atsižvelgiant į susirgimą ir aplinką.

Susirgimo slopinimas buvo registruojamas pagal tokią skalę:

- 4 = susirgimo nėra
- 3 = pėdsakai - 5% susirgimų ant neapdorotų augalų
- 2 = 6 - 25% susirgimų ant neapdorotų augalų
- 1 = 25 - 59% susirgimų ant neapdorotų augalų
- 0 = 60 - 100% susirgimų ant neapdorotų augalų

Rezultatai pateikti 3 Lentelėje.

15 PAVYZDYS

(I) formulės junginių insekticidinės savybės buvo demonstruojamos taip.

Junginių aktyvumas buvo nustatomas, panaudojant įvairius vabzdžius, erkes ir nematodus. Išskyrus aktyvumo atvejį "nok - daunas" prieš *Musca Domestica*, kurio bandymo procedūra aprašyta vėliau, junginiai buvo naudojami kaip skysti preparatai, kuriuose buvo nuo 12,5 iki 1000 dal./mil. junginio svorio. Preparatai buvo paruošiami, ištirpinant junginius acetone ir atskiedžiant tirpalus vandeniu, kuriame buvo 0,1 svorio % drėkinančios medžiagos, parduodamos su prekės ženklu SINPERONIC PX" iki reikiamos produkto koncentracijos.

Bandymo eiga kiekvienam parazitiniam organizmui buvo iš esmės ta pati ir apėmė įvedimą į aplinką, kuri paprastai buvo augalas - šeimininkas, arba į maistą, kuriuo minta kenkėjai, keleto kenksmingų organizmų ir apdorojant preparatu arba kenkėjus arba aplinką, arba ir kenkėjus ir aplinką. Kenkėjų mirtinumas buvo vertinamas po vienos-septynių dienų po apdorojimo.

Bandymų rezultatai pateikti 4 Lentelėje kiekvienam iš junginių, nurodytų pirmame stulpelyje, antrame stulpelyje nurodant sunaudojimą dalelėmis/milijonui. Rezultatai parodyti kaip mirtingumo laipsnis, žymimas kaip 9,5 arba 0, kur 9 reiškia 80-100 % mirtingumą (70-100% sumažėję šaknų gumbai, palyginus su neapdorotais augalais in vitro bandyme su *Meloidogyne incognita*), 5 rodo 50 - 79% mirtingumą (50 - 69% gumų sumažėjimas in vitro bandyme su *Meloidogyne incognita*) ir 0 reiškia mažesnę negu 50% mirtingumą.

4 Lentelėje naudojami kenkėjai žymimi raidiniu kodu. Kodo reikšmė, terpė-nešėjas arba maistas, bandymo tipas ir trukmė

pateikti 5 Lentelėje.

Savybė sukelti "nokdauną" *Musca domestica* atžvilgiu buvo pademonstruota taip.

Junginio pavyzdys buvo atskiestas 0,1% etanolio/acetono mišiniu (50:50), ir koncentracija buvo padaryta 1000 dal./mil., naudojant 0,1% SINPERONIK PX vandeninį tirpalą. Tirpalas (1 ml) buvo išpurškiamas ant mišrios lyties musių, laikomų gėrimo puodelyje su gabalėliu cukraus, kuris taip pat buvo apipurkštas.

Po apipurškimo puodeliai iš karto buvo apverčiami ir palikti džiūti. "Nokdauno" įvertinimas buvo atliekamas po 15 minučių, kai puodeliai vėl buvo atversti į normalią padėtį. Po to, norint įvertinti mirtingumą, musės buvo apdengtos drėgnu vatos tamponu ir laikomos 48 valandas patalpoje, kurioje buvo 25°C temperatūra ir 65 % santykinis drėgnumas.

3 Lentelė

Junginio Nr.	Lentelės Nr.	PUCCINIA RECONDITA (kviečiai)	ERYSIPHE GRAMINIS HORDEI (miežiai)	VENTURIA INAEQUA- LIS (obelys)	PYRICULA- RIA ORYZAE (ryžiai)	CERCOSPORA ARACHIDI - COLA (žemės rie- šutai)	PLASMOPARA VITICOLA (vynuogės)	PHYTOPHTHORA INFESTANS (pomidorai)
1	I	-	3	4	4	4	4	4
2	I	4	4	4	4	4	4	3
5	I	4	4	4	-	4	4	3
6	I	-	4	4	3	4	4	4
11	I	4	4	4	-	4	4	3
17	I	4	4	4	-	4	4	3
20	I	4	4	4	-	4	4	3
22	I	3	4	4	-	4	4	4
23	I	4	4	4	-	4	4	4
29	I	4	1	4	-	4	4	1
32	I	3	4	4	4	4	4	3
37	I	4	4	4	-	4	4	4
38	I	4	4	4	-	4	4	0
39	I	3	0	0	-	2	0	0
40	I	4	4	4	-	4	4	4

3 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	Lente- lės Nr.	PUCCINIA RECONDITA (kviečiai)	FRYSIPHE GRAMINIS HORDEI (miežiai)	VENTURIA INAEQUA- LIS (obelys)	PYRICULA- RIA ORYZAE (ryžiai)	CERCOSPORA ARACHIDI - COLA (žemės rie- šutai)	PLASMOPARA VITICOLA (vynuogės)	PHYTOPHTHORA INFESTANS (pomidorai)
41	1	3	4	2	0	-	4	4
42	1	1	0	4	-	3	4	3
45	1	3	4	4	0	-	2	2
47	1	4	4	4	4	4	4	4
49	1	0	0	4	-	2	4	0
55	1	4a	4a	4a	3a	4a	4a	4a
62	1	4	4	4	4	-	4	4
63	1	4	4	4	4	4	4	4
64	1	4	4	4	3	4	4	0
65	1	4	4	4	3	4	4	0
66	1	-	4	4	0	2	4	4
67	1	-	3	0	0	3	4	2

3 Lentele (tėsinys)

Junginio Nr.	Lente- lės Nr.	PUCCINIA RECONDITA (kviečiai)	ERYSIPHE GRAMINIS HORDEI (miežiai)	VENTURIA INAEQUA- LIS (obelys)	PYRICULA- RIA ORYZAE (ryžiai)	CERCOSPORA ARACHIDI - COLA (žemės rie- šutai)	PLASMOPARA VITICOLA (vynuogės)	PHYTOPHTHORA INFESTANS (pomidorai)
89	1	4	4	4	4	4	4	4
90	1	4a	4a	4a	Oa	4a	4a	4a
92	1	4	4	4	-	-	4	4
93	1	3	3	3	-	-	4	3
101	1	4	4	4	3	4	4	3
110	1	4	4	4	-	-	4	2
112	1	4	3	3	3	-	0	0
113	1	4	4	4	4	-	4	4
116	1	4	4	4	-	-	4	4
121	1	4	0	0	3	-	0	0
125	1	4	4	4	3	4	4	3
127	1	4	4	4	-	-	4	4
130	1	4	4	4	-	-	4	2
139	1	3	4	4	0	4	4	0
140	1	3	4	4	3	-	4	3

3 Lentelė (tesinys)

Junginio Nr.	Lente- lės Nr.	PUCCINIA RECONDITA (kviečiai)	ERYSIPHE GRAMINIS HORDEI (miežiai)	VENTURIA INAEQUA- LIS (obelys)	PYRICULA- RIA ORYZAE (ryžiai)	CERCOPORA ARACHIDI - COLA (žemės rie- šutai)	PLASMOPARA VITICOLA (vynuogės)	PHYTOPHTHORA INFESTANS (pomidorai)
143	1	4	4	4	4	4	4	0
144	1	3	4	4	3	-	4	4
152	1	4	4	4	4	2	4	3
153	1	2	0	2	0	2	0	0
154	1	4	4	4	4	-	4	3
156	1	2	4	4	0	3	4	3
157	1	3	4	4	2	3	4	4
158	1	4	3	4	2	3	4	4
159	1	4	4	4	2	3	0	0
162	1	4	4	4	4	4	4	3
165	1	0	0	0	-	1	0	0
173	1	4	4	4	0	4	4	0
174	1	4	-	4	3	4	4	3
175	1	4	4	4	4	4	4	3

3 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	Lente- lės Nr.	PUCCINIA RECONDITA (kviečiai)	ERYSIPHE GRAMINIS HORDEI (miežiai)	VENTURIA INAEQUA- LIS (obelys)	PYRICULA- RIA ORYZAE (ryžiai)	CERCOSPORA ARACHIDI - COLA (žemės rie- šutai)	PLASMOPARA VITICOLA (vynuogės)	PHYTOPHTHORA INFESTANS (pomidorai)
176	1	4	4	4	4	4	4	3
177	1	4	4	4	4	-	4	4
183	1	3a	3a	3a	0a	4a	4a	3a
184	1	4	4	4	2	4	4	4
185	1	4	4	4	-	-	4	2
186	1	4a	4a	4a	-	-	4a	0a
188	1	4	4	4	4	-	4	4
194	1	4	0	4	4	-	4	4

- rezultaty nėra

a - tik 10 dal./mil. lapų apipurskimas

LT 3730 B

4 Lentelė

Junginio Nr.	Suvartojimas (dal./mil.)	TU AC	TU EO	TU NG	MP MC	NC NC	NC NG	ND AK	MD AC	BG NK	BG NC	HV LR	HV LG	SP LR	SP LG	DB LR	MI JC
20	1000 25	9 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	9 9	9 9	0 0	0 0	0 0	0 0	5 5	0 0	0 0	0
22	1000 25	0 0	0 0	0 0	0 0	5 5	9 9	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0
29	1000 25	9 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	9 9	0
32	500 25	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	5 5	5 5	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0
37	1000 25	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	9 9	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0			9 9	0

4 Lentelė (tęsinys)

[illegible]

4 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	Suvartojimas (dal./mil.)	TU AC	TU EO	TU NG	MP MC	NC NC	NC NG	ND AK	MD AC	BG NK	BG NC	HV LR	HV LG	SP LR	SP LG	DB LR	MI JC
62	500				0	0	0	0	5	0	0	0	0	0	0	0	
63	500 12.5	0	0	0	5	0	9	9	9	0	0	0	0	0	0	5	0
64	500 12.5	5	0	0	5	0	0	9	9	0	0	0	0	0	0	5	0
89	500 12.5	0	0	0	0	5	9	5	9	0	0	0	0	0	0	9	0
93	500				0	0	0	0	0	0	0	9		0	0	0	

4 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	Suvartojimas (dal./mil.)	TU AC	TU FO	TU NG	MP MC	NC NC	NC NG	ND AK	MD AC	BG NK	BG NC	HV LR	HV LG	SP LR	SP LG	DB LR	MI JC
101	500 12.5				0	0	0	0	5	0	0	0	5			0	0
112	500 12.5				9	5	5	0	0	0	0	0	0			9	0
125	500 12.5				0	0	0	5	9	0	0	0	0			0	0
140	500					9		0	0	0	0	0	0	0	0	0	
144	500				0	0	0	0	0	0	0	0	9	0	0	9	

4 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	Suvartojimas (dal./mil.)	TU AC	TU EO	TU NG	MP MC	NC NC	NC NG	ND AK	MD AC	BG NK	BG NC	HV LR	HV LG	SP LR	SP LG	DB LR	MI JC
152	500 12.5	0	0	0	0	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
153	500 12.5				0	9		0	0	0	0	9				0	0
157	500				5	0	9	0	0	0	0	0	0	0	0	9	
158	500				0	0	5	0	0	0	0	0	9	0	0	0	
159	500				9	9		0	0	0	0	0	5	5	5	9	

4 Lentelė (tęsinys)

Junginio Nr.	Suvartojimas (dal./mil.)	TU AC	TU FO	TU NG	NP MC	NC NC	NC NG	ND AK	MD AC	BG NK	BG NC	HV LR	HV LG	SP LR	SP LG	DB LR	MI JC
160	500 12.5				5	0	0	9	0	0	0	0	0			0	0
174	500 12.5				0	0	0	9	9	0	5	0	9			9	0
175	500 12.5				0	0	0	0	5	0	0	0	0			5	0
176	500 12.5				0	0	0	9	9	0	0	0	0			0	0
177	500 12.5				0	0	0	5	0	0	0	0	0			5	0

5 Lentelė

Raidinis kodas	Bandymuose naudoti kenkėjų tipai	Terpė/maistas	Bandymo tipas	Trukmė (dienos)
TU AC	<u>Tetranychus urticae</u> Suaugusi varinė erkė	Paprastos pupelės lapai	Kontaktinis	3
TU EO	<u>Tetranychus urticae</u> Varinės erkės kiaušiniai	Paprastos pupelės lapai	Kontaktinis	3
TU NG	<u>Tetranychus urticae</u> Varinės erkės nimfa	Paprastos pupelės lapai	Kontaktinis (augimas)	6
MP MC	<u>Myzus persicae</u> Amaras	Kinietiškių kopūstų lapai	Kontaktinis	3
NC NC	<u>Nephotettix cincticeps</u> Žaliasis šokuojas vabzdys - nimfa	Ryžių augalai	Kontaktinis	2
NC NG	<u>Nephotettix cincticeps</u> Žaliasis šokuojas vabzdys-nimfa	Ryžių augalai	Kontaktinis (augimas)	6

5 lentelė (tęsinys)

Raidinis kodas	Bandymuose naudoti kenkėjų tipai	Terpė/maistas	Bandymo tipas	Trukmė (dienos)
MD AK	<u>Musca domestica</u> Suaugusi naminė musė	Plastmasinis lovelis	Kontaktinis (nokdaunas)	15 min.
MD AC	<u>Musca domestica</u> Suaugusi naminė musė	Plastmasinis lovelis	Kontaktinis	3
BG NK	<u>Blatella germanica</u> Tarakono nimfa	Plastmasinis lovelis	Kontaktinis (nokdaunas)	15 min.
BG NC	<u>Blatella germanica</u> Tarakono nimfa	Plastmasinis lovelis	Kontaktinis	2
HV LR	<u>Heliothis virescens</u> Tabako pelėdgalvio lerva	Medvilnės lapai	Liekamasis	2
HV LG	<u>Heliothis virescens</u> Tabako pelėdgalvio lerva	Medvilnės lapai	Liekamasis (augimas)	5

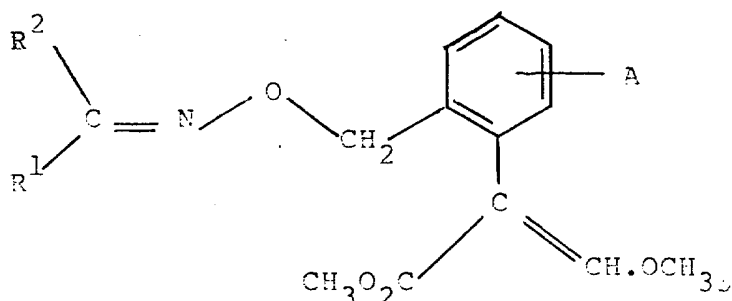
5 Lentelė (tęsinys)

Raidinis kodas	Bandymuose naudoti kenkėjų tipai	Terpė/maistas	Bandymo tipas	Trukmė (dienos)
SP LR	<u>Spodoptera exigua</u> Kirmino-žygeivio lerva	Medvilnės lapai	Liekamasis	2
SP LG	<u>Spodoptera exigua</u> Kirmino-žygeivio lerva	Medvilnės lapai	Liekamasis (augimas)	5
DB LR	<u>Diabrotica balteata</u> Agurkų lapgraužio lerva	Filtravimo popierius/kukurūzų grūdai	Liekamasis	2
MI JC	<u>Meloidogyne incognita</u> Šakninio nematodo lerva	<u>in vitro</u> Mėgintuvėlyje	Kontaktinis	1

Terminas "kontaktinis" bandymas reiškia, kad buvo apdorojami ir kenkėjai, ir terpė, o terminas "liekamasis" bandymas reiškia, kad terpė buvo apdorojama prieš užkrečiant kenkėjais.

IŠRADIMO APIBRĖŽTIS

1. Junginys, kurio formulė (I):



ir jo stereoisomerai, kuriuose A yra vandenilis, halogenas, hidroksi, C_{1-4} alkilas, C_{1-4} alkoksi, C_{1-4} halogenalkilas, C_{1-4} halogenalkoksi, C_{1-4} alkilkarbonilas, C_{1-4} alkoksikarbonilas, fenoksi, nitro arba ciano;

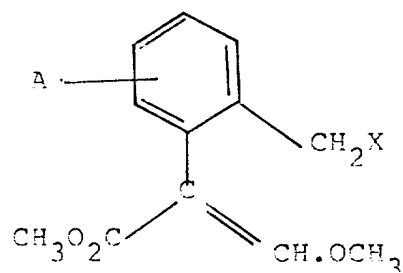
R^1 ir R^2 , kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis, galimai pakeistas alkilas, galimai pakeistas cikloalkilas, galimai pakeistas heterociklilalkilas, galimai pakeistas cikloalkilalkilas, galimai pakeistas aralkilas, galimai pakeistas heteroarilalkilas, galimai pakeistas ariloksialkilas, galimai pakeistas heteroariloksialkilas, galimai pakeistas alkenilas, galimai pakeistas alkinilas, galimai pakeistas alkoksi, galimai pakeistas arilas, galimai pakeistas heteroarilas, galimai pakeistas ariloksi, galimai pakeistas heteroariloksi, nitro, halogenas, ciano, $-\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{CO}_2\text{R}^3$, $-\text{CONR}^3\text{R}^4$, $-\text{COR}^3$, $-\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$, kur n yra 0, 1 arba 2, $(\text{CH}_2)_m\text{PO}(\text{OR}^3)_2$, kur m yra 0 arba 1, arba R^1 ir R^2 sujungti, sudarant karbociklinę arba heterociklinę žiedinę sistemą;

R^3 ir R^4 , kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis, galimai pakeistas alkilas, galimai pakeistas aralkilas, galimai pakeistas alkenilas, galimai pakeistas alkinilas, galimai pakeistas arilas arba galimai pakeistas heteroarilas.

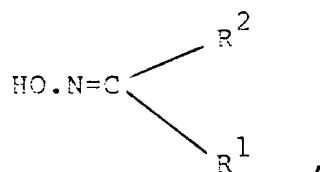
2. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo , kad A yra vandenilis, halogenas, hidroksilas, metoksi, trifluorometilas, trifluormetoksi, C_{1-2} alkilkarbonilas, C_{1-2} alkoksikarbonilas, fenoksi, nitro arba ciano; R^1 yra C_{1-4} alkilas, halogen(C_{1-4})alkilas, C_{1-4} alkoksi, halogen(C_{1-4})alkoksi, C_{1-4} alkilkarbonilas, C_{1-4} alkoksikarbonilas, ciano, fenil(C_{1-4})alkilas, fenilas, penkianaris arba šešianaris aromatinis heterociklas, kuriame yra vienas ar daugiau deguonies, azoto arba sieros atomų ir kuris galimai kondensuotas su benzeno žiedu, be to, bet kurio iš aukščiau paminėtų pakaitų aromatiniai arba heteroaromatiniai fragmentai yra galimai pakeisti vienu ar daugiau pakaitų, parinktų iš halogeno, hidroksilo, C_{1-4} alkilo, halogen(C_{1-4})alkilo, C_{1-4} alkoksi, halogen(C_{1-4})alkoksi, C_{1-4} alkilkarbonilo, C_{1-4} alkoksikarbonilo, nitro, ciano, fenilo, fenoksi, benzilo arba benziloksi; ir R^2 yra vandenilis, halogenas, C_{1-4} alkilas, halogen(C_{1-4})alkilas, C_{1-4} alkilkarbonilas, C_{1-4} alkoksikarbonilas, ciano arba fenilas; arba R^1 ir R^2 sujungti kartu, sudarant C_{5-10} karbociklinę žiedinę sistemą.
3. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo , kad A yra vandenilis arba halogenas, R^1 yra C_{1-4} alkilas, benzilas, C_{1-4} alkilkarbonilas, C_{1-4} alkoksikarbonilas, ciano, fenilas, tienilas, triazolilas, tiazolilas, piridilas, pirimidinilas, pirazinilas, triazinilas, chinolinilas arba chinoksalinilas, be to, bet kurio iš priešėinančių radikalų aromatinis ir heteroaromatinis fragmentai yra galimai pakeisti vienu ar daugiau pakaitų, parinktų iš halogeno, C_{1-4} alkilo, trifluormetilo, C_{1-4} alkoksi, trifluormetoksi, nitro, ciano, fenilo arba benziloksi; R^2 yra vandenilis, C_{1-4} alkilas, C_{1-4} alkilkarbonilas, C_{1-4} alkoksikarbonilas, ciano arba fenilas; arba R^1 ir R^2 yra sujungti kartu, sudarant ciklopentilini ar-

ba cikloheksilini žiedą, su kuriuo paprastai kondensuotas benzeno žiedas.

4. Junginio pagal 1 punktą gavimo būdas, b e s i s k i r i a n -
t i s tuo, kad (II) formulės junginį



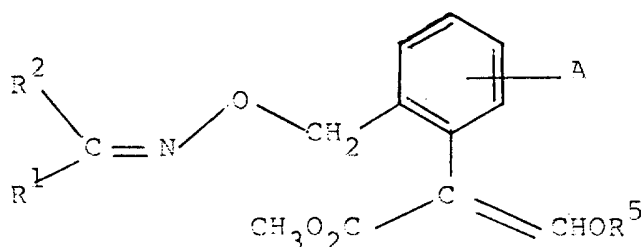
kur A turi reikšmes, nusakytas 1 punkte, ir X yra atskylan-
ti grupė, paveikia (III) formulės oksimo druska



kur R¹ ir R² turi 1 punkte nusakytas reikšmes, bazinėse
sąlygose.

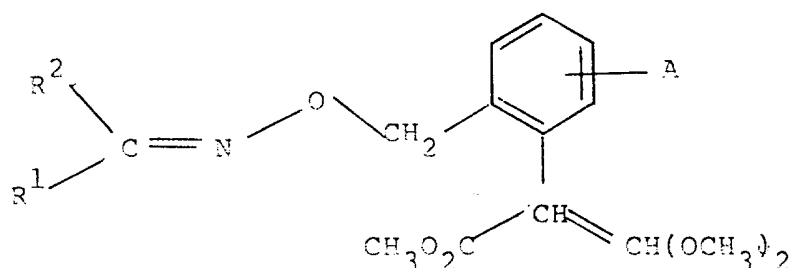
5. Junginių pagal 1 punktą gavimo būdas, b e s i s k i r i a n u t i s
t i s tuo, kad

a) (IX) formulės junginį:



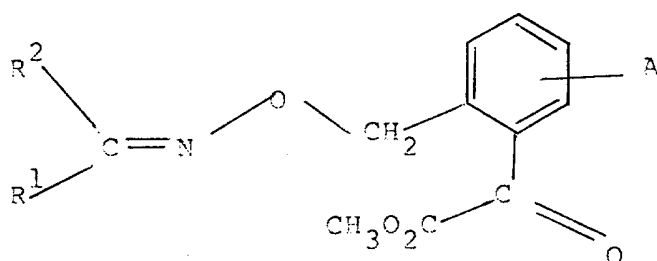
paveikia formulės CH_3Li junginiu; arba

b) atskiria metanolio elementus iš (IV) formulės junginio:



rūgštinėse arba bazinėse sąlygose; arba

c) (XI) formulės ketoesterį: R



paveikia metoksimetileninimo reagentu; kur A, R^1 ir R^2 turi reikšmes, nusakytas 1 punkte, L yra atskylanti grupė, o R^5 yra metalo atomas.

6. Fungicidinė, insekticidinė arba miticidinė kompozicija, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad į jos sudėtį kaip aktyvus ingredientas įeina junginys, apibrėžtas 1 punkte, ir fungicidiškai, insekticidiškai arba miticidiškai priimtinas jo nešiklis arba skiediklis.
7. Kovos su grybeliais, naikinimo arba kovos su vabzdžiais ar erkėmis būdas, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad augalus, augalų sėklas, vabzdžius ar erkes arba jų paplitimo vietas apdoroja junginiu pagal 1 punktą fungicidiškai, insekticidiškai arba miticidiškai efektyviu kiekiu.