

(19)



(10) **LT 4112 B**

(12)

PATENTO APRAŠYMAS

- (11) Patent numeris: **4112**
- (21) Paraiškos numeris: **96-071**
- (22) Paraiškos padavimo data: **1996 05 16**
- (41) Paraiškos paskelbimo data: **1996 12 27**
- (45) Patent paskelbimo data: **1997 02 25**
- (51) Int. Cl.⁶: **C07D 129/12**
C07D 261/12
C07D 275/03
C07D 231/14
C07D 233/30
A01N 43/74
A01N 43/56
A01N 43/653
A01N 43/50
- (86) Tarptautinės paraiškos numeris: **PCT/US94/09525**
- (86) Tarptautinės paraiškos padavimo data: **1994 08 30**
- (85) Nacionalinės procedūros pradžia: **1996 05 16**
- (31, 32, 33) Prioritetas: **155963, 1993 11 19, US**
155970, 1993 11 19, US
- (72) Išradėjas:
Richard James Brown, US
King-Mo Sun, US
Deborah Ann Frasier, US
- (73) Patent savininkas:
E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY, 1007 Market Street,
Wilmington, DE 19898, US
- (74) Patentinis patikėtinis:
Genė Ona Sruogienė, 12, UAB "TARPINĖ",
A.P.Kavoliuko g. 24-152, 2050 Vilnius, LT

- (54) Pavadinimas:
Fungicidiniai cikliniai amidai

- (57) Referatas:

Cikliniai amidai, kurie naudojami kaip fungicidai, kurių bendra formulė I, kurioje:
A yra O; S; N; NR⁵; arba CR¹⁴;
G yra C arba N;
W yra O arba S;
X yra OR¹, S(O)_mR halogenas;

LT 4112 B

R^1 , R^2 ir R^5 nepriklausomai vienas nuo kito, iš dalies, yra C_1 - C_6 -alkilas;

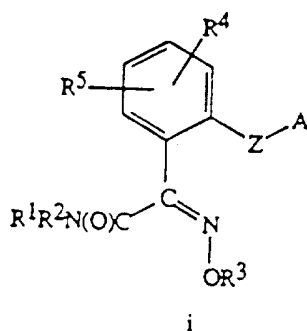
Y gali būti $-O-$; $-S(O)_n$; $-CHR^6O-$; $-OCHR^6-$ arba $-CHR^6O-N=C(R^7)-$;

Z gali būti galimai pakeistas cikloalkilas, fenilas, piridinilas, pirimidinilas arba naftilas; ir

R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , R^{14} , m ir n yra nurodyti aprašyme.

Išradime pateikti cikliniai amidai, pakeisti α -padėtyje įvairiomis arilo grupėmis, jų agrotechniškai tinkamos druskos ir kompozicijos ir jų, kaip bendrų arba selektyvių fungicidų, panaudojimo būdai.

Europos patente EP-A-398 692 aprašyti amidai, kurių formulė (i), kaip derliaus apsaugos fungicidai. Formulės (i) junginiai yra:

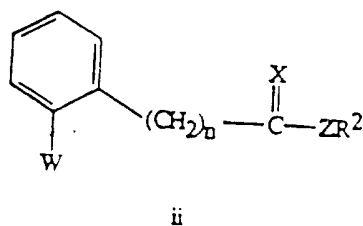


kurioje

R^1 ir R^2 kiekvienas yra vandenilis, žemesnysis alkilas arba žemesnysis cikloalkilas.

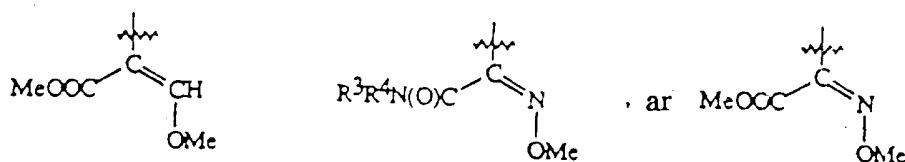
Visi junginiai, aprašyti EP-A-398 692, turi arilo pusę, sujungtą su aciklinio alkoksiiminoacitamido grupe. Jame neaprašyti cikliniai amidai pagal šį išradimą.

Paraiškoje WO 93/07116 aprašyti junginiai, kurių bendra formulė (ii), kaip derliaus apsaugos fungicidai. Junginiai, kurių bendra formulė (ii) yra:



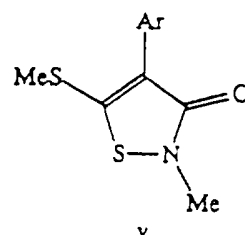
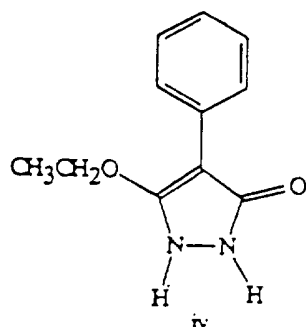
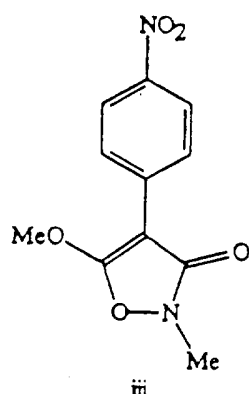
kurioje:

W yra



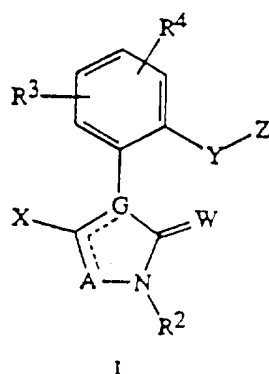
Šio išradimo cikliniai amidai nurodytoje paraiškoje taip pat neaprašyti.

J. Heterocyclic Chem., (1987), 24,465, J. Heterocyclic Chem., (1988), 25, 1307, and Australian J. Chem., (1977), 30 (8), 1815 aprašomi, atitinkamai, 4-nitrofenilizoksazolai (iii), fenilpirazolonai (iv) ir ariltiazolinonai (v).



Tačiau apie fungicidinį panaudojimą ir ortopakeistus junginius pagal išradimą nurodytoje literatūroje nekalbama.

Šiame išradime pateikti junginiai, kurių bendra formulė (I) apima visus geometrinius izomerus ir stereoizomerus, jų agrotechniškai tinkamas druskas, agrotechninius junginius, į kuriuos jie įeina, ir jų, kaip fungicidų, panaudojimą:



kurioje

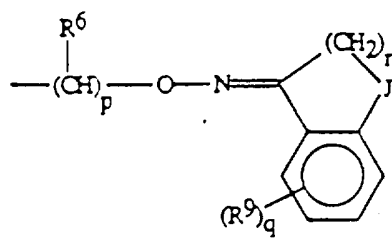
A yra O; S; N; NR⁵; arba CR¹⁴;

G yra C arba N; su sąlyga, kad kai G yra C, A yra O, S arba NR⁵ ir fliktuojanti dviguba jungtis yra prijungta prie G; ir kai G yra N, A yra N arba CR¹⁴ ir fliktuojanti dviguba jungtis yra prijungta prie A;

W yra O arba S;

X yra OR¹; S(O)_mR¹; arba halogenas;

- R^1 , R^2 ir R^5 kiekvienas nepriklausomai yra H; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_2 - C_6 -alkenilas; C_2 - C_6 -halogenalkenilas; C_2 - C_6 -alkinilas; C_2 - C_6 -halogenalkinilas; C_3 - C_6 -cikloalkinilas; C_2 - C_4 -alkilkarbonilas; C_2 - C_4 -alkoksikarbonilas; arba benzoilas, galimai pakeistas R^{13} ;
- R^3 ir R^4 kiekvienas nepriklausomai yra H; ciano; nitro; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_2 - C_6 -alkenilas; C_2 - C_6 -halogenalkenilas; C_2 - C_6 -alkinilas; C_2 - C_6 -halogenalkinilas; C_1 - C_6 -alkoksi; C_1 - C_6 -halogenalkoksi; C_2 - C_6 -alkeniloksi; arba C_2 - C_6 -alkiniloksi;
- Y yra -O-; -S(O) $_n$ -; -CHR⁶-CHR⁶-; -CR⁶=CR⁶-; -C≡C-; -CHR⁶O-; OCHR⁶-; -CHR⁶S(O) $_n$ -; -S(O) $_n$ CHR⁶-; -CHR⁶O-N=C(R⁷)-; -(R⁷)C=N-OCH(R⁶)-; -C(R⁷)=N-O-; -O-N=C(R⁷)-; -CHR⁶OC(=O)N(R¹⁵)-; arba tiesioginė jungtis; ir Y ryšio kryptis yra apibrėžta taip, kad dalis, atvaizduota į kairę ryšio pusę, yra sujungta su fenilo žiedu ir dalis, atvaizduota į dešinę ryšio pusę, yra sujungta su Z;
- R^6 yra nepriklausomai H arba C_1 - C_3 -alkilas;
- R^7 yra H; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_1 - C_6 -alkoksi; C_1 - C_6 -halogenalkoksi; C_2 - C_6 -alkenilas; C_2 - C_6 -halogenalkenilas; C_2 - C_6 -alkinilas; C_2 - C_6 -halogenalkinilas; C_3 - C_6 -cikloalkilas; C_2 - C_4 -alkilkarbonilas; C_2 - C_4 -alkoksikarbonilas; ciano; arba morfolinas;
- Z yra C_1 - C_6 -alkilas, C_2 - C_{10} -alkenilas, arba C_2 - C_{10} -alkinilas, kiekvienas galimai pakeistas R^8 ; arba Z yra C_3 - C_8 -cikloalkilas arba fenilas, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^9 , R^{10} , arba abiem R^9 ir R^{10} ; arba Z yra nuo 3 iki 14-nario nearomatinio heterociklinio žiedo sistema, parinkta iš monociklinio žiedo sistemos, kondensuoto biciklinio žiedo ir kondensuoto triciklinio žiedo, arba Z yra nuo 5 iki 14-nario aromatinio žiedo sistema, parinkta iš monociklinio žiedo, kondensuoto biciklinio žiedo ir kondensuoto triciklinio žiedo grupės, kiekvieno nearomatinio arba aromatinio žiedo sistema turi nuo 1 iki 6 heteroatomų, nepriklausomai parinktų iš grupės 1-4 azoto atomų, 1-2 deguonies atomų ir 1-2 sieros atomų, kiekviena nearomatinio arba aromatinio žiedo sistema galimai pakeista vienu iš R^9 , R^{10} arba abiem R^9 ir R^{10} ; arba
- R^7 ir Z kartu yra paimti iš $CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2OCH_2CH_2$, kiekviena CH_2 grupė galimai, pakeista 1-2 halogeno atomais; arba
- Y ir Z kartu sudaro R^3 ;



Y ir Z kartu su fenilo žiedu sudaro naftaleno žiedą, pakeistą bet kuriame žiede nepastovioje vietoje R^4 grupe, su sąlyga, kad kai R^3 , Y ir Z paimti kartu su fenilo žiedu suformuoja naftaleno žiedą, pakeistą R^4 , ir A yra S, W yra O, X yra SCH_3 ir R^2 yra CH_3 , tada R^4 yra ne H; J yra $-\text{CH}_2-$; $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$; $-\text{OCH}_2-$; $-\text{CH}_2\text{O}-$; $-\text{SCH}_2-$; $-\text{CH}_2\text{S}-$; $-\text{N}(\text{R}^{16})\text{CH}_2-$; arba $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{16})-$; kiekviena CH_2 grupė, galimai pakeista nuo 1 iki 2 CH_3 ;

R^8 yra 1-6 halogeno atomai; C_1 - C_6 -alkoksi; C_1 - C_6 -halogenalkoksi; C_1 - C_6 -alkiltio; C_1 - C_6 -halogenalkiltio; C_1 - C_6 -alkilsulfinilas; C_1 - C_6 -alkilsulfonilas; C_3 - C_6 -cikloalkilas; C_3 - C_6 -alkeniloksi; $\text{CO}_2(\text{C}_1$ - C_6 -alkilas); $\text{NH}(\text{C}_1$ - C_6 -alkilas); $\text{N}(\text{C}_1$ - C_6 -alkilas) $_2$; ciano arba nitro; arba R^8 yra fenilas, fenoksi, piridinilas, piridiniloksi, tienilas, furanilas, pirimidinilas, arba pirimidiniloksi, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^{11} , R^{12} , arba abiem R^{11} ir R^{12} ;

R^9 yra 1-2 halogeno atomai; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_1 - C_6 -alkoksi; C_1 - C_6 -halogenalkoksi; C_2 - C_6 -alkenilas; C_2 - C_6 -halogenalkenilas; C_2 - C_6 -alkinilas; C_1 - C_6 -alkiltio; C_1 - C_6 -halogenalkiltio; C_1 - C_6 -alkilsulfinilas; C_1 - C_6 -alkilsulfonilas; C_3 - C_6 -cikloalkilas; C_3 - C_6 -alkeniloksi; $\text{CO}_2(\text{C}_1$ - C_6 -alkilas); $\text{NH}(\text{C}_1$ - C_6 -alkilas); $\text{N}(\text{C}_1$ - C_6 -alkilas) $_2$; $-\text{C}(\text{R}^{18})=\text{NOR}^{17}$; ciano arba nitro; arba R^9 yra fenilas, benzilas, benzoilas, fenoksi, piridinilas, piridiniloksi, tienilas, tieniloksi, furanilas, pirimidinilas, arba pirimidiniloksi, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^{11} , R^{12} , arba abiem R^{11} ir R^{12} ;

R^{10} yra halogenas; C_1 - C_4 -alkilas; C_1 - C_4 -halogenalkilas; C_1 - C_4 -alkoksi; nitro; arba ciano; arba

R^9 ir R^{10} , kai prijungtas gretimas atomas, yra paimti kartu kaip $-\text{OCH}_2\text{O}-$ arba $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$; kiekviena CH_2 grupė galimai pakeista 1-2 halogeno atomais;

R^{11} ir R^{12} kiekvienas nepriklausomai yra halogenas; C_1 - C_4 -alkilas; C_1 - C_4 -halogenalkilas; C_1 - C_4 -alkoksi; C_1 - C_4 -halogenalkoksi; nitro; arba ciano;

R^{13} yra halogenas; C_1 - C_3 -alkilas; C_1 - C_3 -halogenalkilas; C_1 - C_3 -alkoksi; C_1 - C_3 -halogenalkoksi; nitro; arba ciano;

R^{14} yra H; halogenas; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_2 - C_6 -alkenilas; C_2 - C_6 -halogenalkenilas; C_2 - C_6 -alkinilas; C_2 - C_6 -halogenalkinilas; arba C_3 - C_6 -cikloalkinilas;

R^{15} , R^{16} , R^{17} ir R^{18} kiekvienas nepriklausomai yra H; C_1 - C_3 -alkilas; arba fenilas, galimai pakeistas halogenu, C_1 - C_4 -alkilu; C_1 - C_4 -halogenalkilu; C_1 - C_4 -alkoksi; C_1 - C_4 -halogenalkoksi, nitro arba ciano;

m, n ir q kiekvienas nepriklausomai yra 0, 1 arba 2; ir

p ir r kiekvienas nepriklausomai yra 0 arba 1.

Aukščiau naudotas terminas "alkilas", panaudotas vienas arba žodžių junginyje, pavyzdžiui, "halogenalkilas", reiškia linijinį arba šakotąjį alkilą, t. y. metilą, etilą, n-propilą, i-propilą arba skirtingus butilą, fenilą arba heksilą izomeras. "Alkenilas" reiškia linijinius arba šakotuosius alkenus, pavyzdžiui, 1-propenilą, 2-propenilą ir skirtingus butenilą, pentenilą ir heksenilą izomeras. "Alkenilas" tai pat reiškia polieną, tokį kaip 1,3-heksadienas. "Alkinilas" reiškia linijinius arba šakotuosius alkinus, pavyzdžiui, etinilą, 1-propinilą, 3-propinilą ir heksinilą izomeras. "Alkinilas" taip pat gali reikšti dalis, sudarytas iš daugelio trigubų jungčių, pavyzdžiui, 2,4-heksadienas. "Alkoksi" reiškia, pavyzdžiui, metoksi, etoksi, n-propiloksi, izopropiloksi ir skirtingus butoksi, pentoksi ir heksiloksi izomeras. "Alkeniloksi" reiškia linijinio arba šakotojo alkeniloksi dalis. Alkeniloksi pavyzdžiai apima $H_2C=CHCH_2O$, $(CH_3)_2C=CHCH_2O$. "Alkiniloksi" reiškia linijinio arba šakotojo alkiniloksi dalis. Pavyzdžiai apima $HC\equiv CCH_2O$, $CH_3C\equiv CCH_2CH_2O$. Terminas "halogenas" vienas arba žodžių, tokių kaip "halogenalkoksi", junginyje reiškia fluorą, chlorą, bromą arba jodą. Toliau, kai bus panaudotas žodžių junginys, toks kaip "halogenalkilas", šis alkilas gali būti dalinai arba pilnai pakeistas halogeno atomais, kurie gali būti vienodi arba skirtingi. "Halogenalkilo" pavyzdžiai apima F_3C , $ClCH_2$, CF_3CH_2 ir CF_3CCl_2 . Terminas "cikloalkilas" apima ciklopropilą, ciklopentilą ir cikloheksilą dalis. Terminas "nearomatinė heteraciklinio žiedo sistema" apima pilnai išotintus heterociklus ir dalinai aromatinčius heterociklus. Visas anglies atomų skaičius pakaito grupėje yra pažymėtas " C_i-C_j ", kur indeksai i ir j yra skaičiai nuo 1 iki 10. Pavyzdžiui, C_1 - C_3 -alkilas žymi nuo metilo iki propilo; C_2 -alkoksi žymi CH_3CH_2O ; ir C_3 -alkoksi žymi, pavyzdžiui, CH_3CH_2O arba $(CH_3)_2CHO$. Kaip aukščiau nurodyta, kai junginys, kurio bendra formulė I, sudarytas iš vieno arba daugiau aromatinių azotą turinčių žiedų (t.y., piridinilą ir pirimidinilą), visos šių heterociklų jungtys yra sudarytos per minėtų dalių anglies atomą(us).

Siūlomi junginiai, juos turinčios kompozicijos ir jų panaudojimo būdai jų geresnio aktyvumo ir/arba paprastesnės sintezės tikslu, yra:

I pasiūlymas. Aukščiau pateiktos formulės I junginiai, kuriuose:

W yra O;

R^1 yra alkilas arba halogenalkilas;

R^2 yra H; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; arba C_3 - C_6 - cikloalkilas;

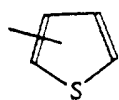
R^3 ir R^4 kiekvienas nepriklausomai yra H; halogenas; ciano; nitro;

C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_1 - C_6 -alkoksi; arba C_1 - C_6 -halogenalkoksi;

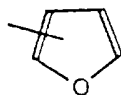
Y yra $-O-$; $-CH=CH-$; $-CH_2O-$; $-OCH_2-$; $-CH_2S(O)_n-$; $-CH_2O-N=C(R^7)-$; $-C(R^7)=N-O-$; $-CH_2OC(O)NH-$; arba tiesioginis ryšys;

R^7 yra H; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_2 - C_6 -alkenilas; C_1 - C_6 -alkinilas; arba ciano;

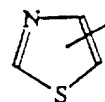
Z yra C_1 - C_6 -alkilas, galimai pakeistas R^8 ; arba C_3 - C_8 -cikloalkilas arba fenilas, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^9 , R^{10} arba abiem R^9 ir R^{10} ; arba Z yra



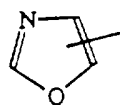
Z-1



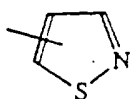
Z-2



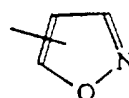
Z-3



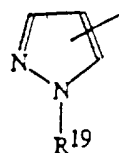
Z-4



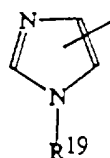
Z-5



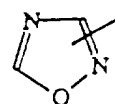
Z-6



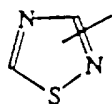
Z-7



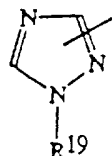
Z-8



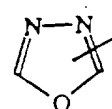
Z-9



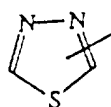
Z-10



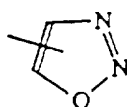
Z-11



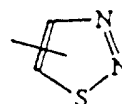
Z-12



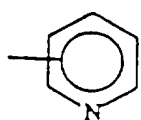
Z-13



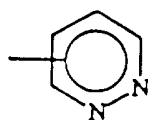
Z-14



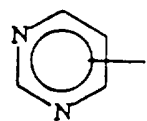
Z-15



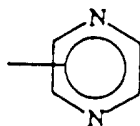
Z-16



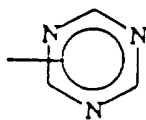
Z-17



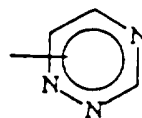
Z-18



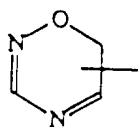
Z-19



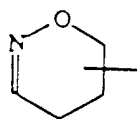
Z-20



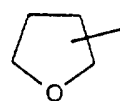
Z-21



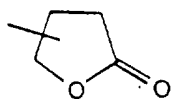
Z-22



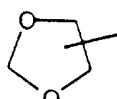
Z-23



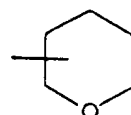
Z-24



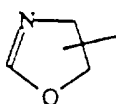
Z-25



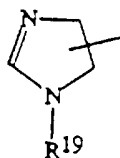
Z-26



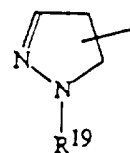
Z-27



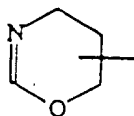
Z-28



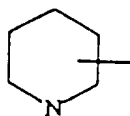
Z-29



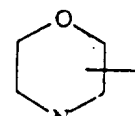
Z-30



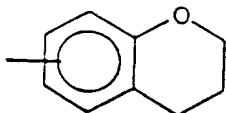
Z-31



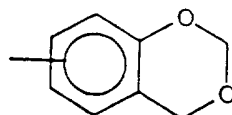
Z-32



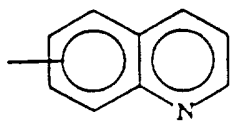
Z-33



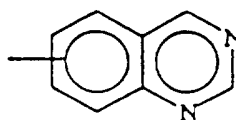
Z-34



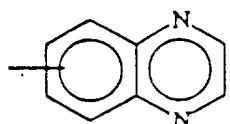
Z-35



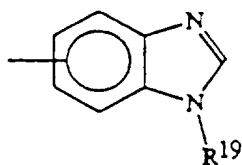
Z-36



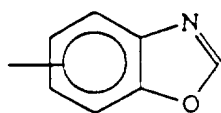
Z-37



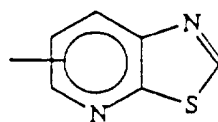
Z-38



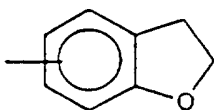
Z-39



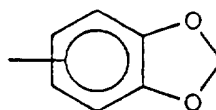
Z-40



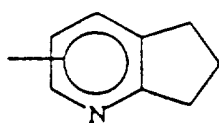
Z-41



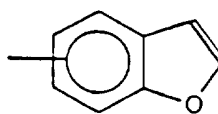
Z-42



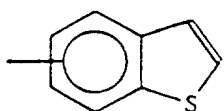
Z-43



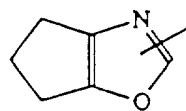
Z-44



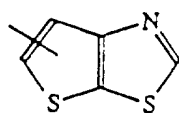
Z-45



Z-46

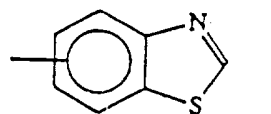


Z-47



Z-48

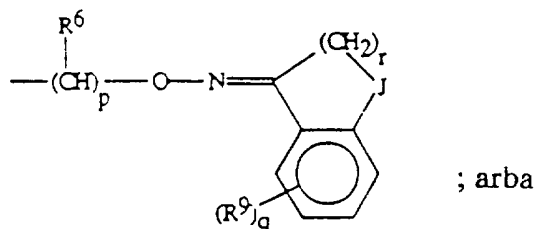
arba



Z-49

kiekviena grupė galimai pakeista vienu iš R^9 , R^{10} arba
abiem R^9 ir R^{10} ; arba

R^3 , Y ir Z paimti kartu su fenilo žiedu sudaro naftaleno žiedą,
pakeistą bet kuriame vienu iš dviejų žiedų fliktuojančiu R^4 ; arba
Y ir Z paimti kartu suformuoja



; arba

R^8 yra 1-6 halogeno atomai; C_1 - C_6 -alkoksi; C_1 - C_6 -halogenalkoksi; arba R^8 yra
fenilas, fenoksi, piridinilas, piridiniloksi, pirimidinilas, arba
pirimidiniloksi, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^{11} , R^{12} arba
abiem R^{11} ir R^{12} ;

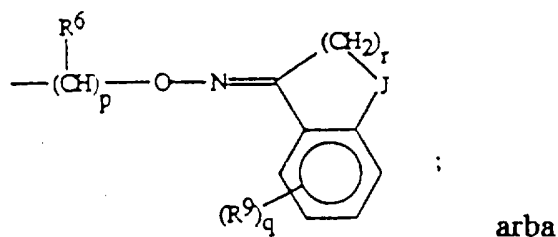
R^9 yra 1-2 halogeno atomai; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_1 - C_6 -
alkoksi; C_1 - C_6 -halogenalkoksi; C_1 - C_6 -alkiltio; ciano; CO_2 (C_1 - C_6 -
alkilas); NH (C_1 - C_6 -alkilas); arba N (C_1 - C_6 -alkilas) $_2$; arba R^9 yra C_3 -
 C_6 -cikloalkilas, fenilas, fenoksi, piridinilas, piridiniloksi, pirimidinilas,
arba pirimidiniloksi, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^{11} , R^{12}
arba abiem R^9 ir R^{10} ; ir

R^{10} yra H; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; arba fenilas, galimai pakeistas
halogenu, C_1 - C_4 -alkilu, C_1 - C_4 -halogenalkilu, C_1 - C_4 -alkoksi, C_1 - C_4 -
halogenalkoksi, nitro arba ciano.

2 pasiūlymas. 1 pasiūlymo junginiai, kuriuose:

Z yra fenilas arba Z-1 iki Z-21, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^9 , R^{10}
arba abiem R^9 ir R^{10} ; arba

Y ir Z paimti kartu suformuoja



J yra $-\text{CH}_2-$ arba $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$;

p yra O; ir

r yra 1.

3 pasiūlymas. 2 pasiūlymo junginiai, kuriuose:

A yra O; N; NR^5 ; arba CR^{14} ;

X yra OR^1 ;

R^1 yra C_1 - C_3 -alkilas;

R^2 yra H arba C_1 - C_2 -alkilas;

R^3 ir R^4 kiekvienas yra H;

Y yra $-\text{O}-$; $-\text{CH}=\text{CH}-$; $-\text{CH}_2\text{O}-$; $-\text{OCH}_2-$; $-\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{R}^7)-$;

arba $-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{NH}-$;

R^7 yra H; C_1 - C_3 -alkilas; arba R^1 C_1 - C_3 -halogenalkilas; ir

Z yra fenilas, piridinilas, pirimidinilas, arba tienilas, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^9 , R^{10} , arba abiem R^9 ir R^{10} .

4 pasiūlymas. 3 pasiūlymo junginiai, kuriuose:

A yra O arba NR^5 ;

G yra C;

Y yra $-\text{O}-$; $-\text{CH}_2\text{O}-$; $-\text{OCH}_2-$; arba $-\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{R}^7)-$; ir

R^7 yra H; C_1 - C_2 -alkilas; arba R^1 C_1 - C_2 -halogenalkilas.

5 pasiūlymas. 3 pasiūlymo junginiai, kuriuose:

A yra N arba CR^{14} ;

G yra N;

Y yra $-\text{O}-$; $-\text{CH}_2\text{O}-$; $-\text{OCH}_2-$; arba $-\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{R}^7)-$; ir

R^7 yra H; C_1 - C_2 -alkilas; arba R^1 C_1 - C_2 -halogenalkilas.

6 pasiūlymas. 4 pasiūlymo junginiai, kuriuose:

R^1 yra metilas;

R^7 yra metilas; ir

Z yra fenilas, galimai pakeistas vienu iš R^9 , R^{10} , arba abiem R^9 ir R^{10} .

7 pasiūlymas. 6 pasiūlymo junginiai, kur:

R^1 yra metilas;

R^1 yra metilas, ir

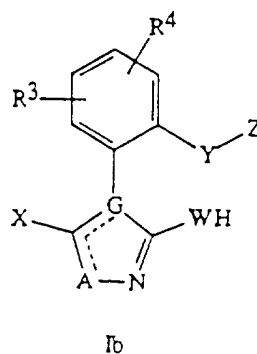
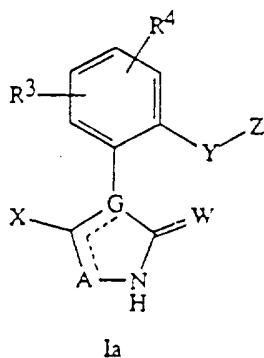
Z yra fenilas, galimai pakeistas vienu iš R^9 , R^{10} , arba abiem R^9 ir R^{10} .

Pripažinta, kad kai kurie reagentai ir žemiau aprašytos reakcijos sąlygos, ruošiant formulės I junginius, gali būti nesuderinami su kai kuriomis funkcijomis, apibrėžtomis R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , A, G, W, X, Y ir Z. Šiais atvejais įvedimas į sintezę apsauginių/nuimančių apsaugą sekų gali būti būtinas, siekiant gauti norimus produktus. Atvejai, kada apsauginės grupės yra reikalingos ir kokias apsaugines grupes naudoti, bus akivaizdūs specialistams, žinantiems cheminę sintezę.

Toliau pateikiamas formulės I junginių paruošimas, junginiai, pažymėti nuo formulės Ia iki formulės Ik imtinai yra įvairūs formulės I junginių pogrupiai. Visi formulių Ia iki Ik ir 1 - 39 junginių pakaitai yra tokie, kaip apibrėžta aukščiau formule I, išskyrus atvejus, kur nurodyta kitaip.

Šie išradimo junginiai gali egzistuoti kaip vienas arba daugiau stereoizomerų. Įvairūs stereoizomerai apima enantiomerus, diastereomerus ir geometrinius izomerus. Šios srities specialistai supras, kad vienas stereoizomeras gali būti aktyvesnis negu kiti ir kaip atskirti šiuos stereoizomerus. Todėl šis išradimas apima kompozicijas, atskirus stereoizomerus ir optiškai aktyvius formulės Ia junginių mišinius, taip pat agrotechniškai tinkamas jų druskas.

Šios srities specialistas supras, kad kai kurie formulės Ia junginiai gali būti vienos arba kelių tautomerinių formų. Pavyzdžiui, formulės I junginys, kurio R^2 yra H, gali egzistuoti kaip formulės Ia arba Ib tautomeras arba abiejų formulių Ia ir Ib tautomeras. Šis išradimas apima visas formulės I tautomerines formas.



Formulės I junginiai gali būti paruošti kaip aprašyta žemiau operacijomis nuo 1) iki 5). Operacijos nuo 1) iki 4) aprašo sintezes, apimančias amido žiedo konstrukciją po to, kai suformuota arilo dalis. 5) operacija aprašo arilo dalies sintezę su jau susiformavusiu amido žiedu.

Formulės I junginiai yra paruošiami apdorojant formulės 1 junginius atitinkamu alkilą nešančiu reagentu inertiškame tirpiklyje su arba be papildomų rūgšties arba bazės reagentų arba kitų reagentų (1 schema). Tinkami tirpikliai yra atrinkti iš grupės, sudarytos iš polinių aprotoninių tirpiklių, tokių kaip acetonitrilas, dimetilformamidas arba dimetilsulfoksidas; eterių, tokių kaip tetrahidrofuranas, dimetoksietanas arba dietileteris; ketonų, tokių kaip acetonas arba 2-butanonas; angliavandenilių, tokių kaip toluenas arba benzenas; ir perhalogenangliavandenilių, tokių kaip dichlormetanas arba trichlormetanas.

$X=OH$ arba SH

$X=OR^1$ arba SR^1

2 būdas:

$$\begin{array}{c} \text{NH} \\ \parallel \\ \text{Cl}_3\text{C} - \text{C} - \text{OR}^1 \end{array} : \text{Liuiso (Lewis) rūgštis}$$

3

4 būdas: $(R^1)_2SO_4$, R^1OSO_2Q ; arba R^1 -hal;
laisvai pasirenkama bazė
(hal = F, Cl, Br, arba I)

Pavyzdžiui, formulės I junginiai gali būti gauti veikiant formulės 2 diazoalkano reagentus, tokius kaip diazometaną ($Q = H$) arba trimetilsilildiazometaną ($Q =$

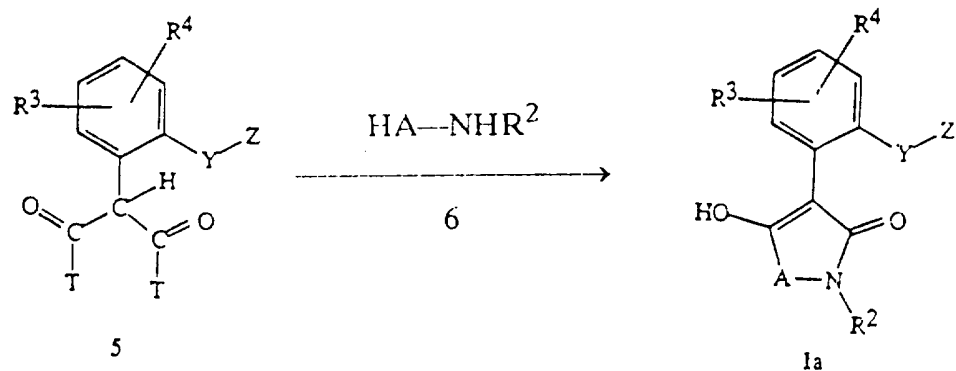
$(\text{CH}_3)_3\text{Si}$) formulės 1 (1 būdas) dikarbonilniais junginiais. Trimetilsilildiazometano panaudojimas reikalauja sąveikaujančio protoninio tirpiklio, tokio kaip metanolis. Tokių operacijų pavyzdžiai yra *Chem. Pharm. Bull.*, (1984), 32, 3759.

Kaip parodyta 2 būde, formulės I junginiai taip pat gali būti paruošti kontaktuojant formulės 1 karbonilo junginiais su formulės 3 alkiltrichloracetimidatais ir Liuiso (Lewis) rūgščių katalizatoriumi. Tinkamos Liuiso rūgštys apima trimetilsililo triflatą ir tetrafluorborato rūgštis. Alkilo trichloracetimidatai gali būti paruošti iš tinkamo alkoholio ir trichloracetonitrilo, kaip aprašyta literatūroje (J. Danklmaier and H. Honig, *Synth. Commun.*, (1990), 20, 203).

Formulės I junginiai taip pat gali būti paruošti formulės 1 junginius apdorojant formulės 4 (3 būdas) trialkiloksaminio tetrafluorboratu (t.y. Mejerveino (Meerwein) druska). Trialkiloksaminio druskų, kaip veiksmingų alkilavimo medžiagų, panaudojimas yra gerai žinomas (žiūrėti U. Schollkopf, U. Groth, C. Deng, *Angew. Chem., Int. Ed. Engl.*, (1981), 20, 798).

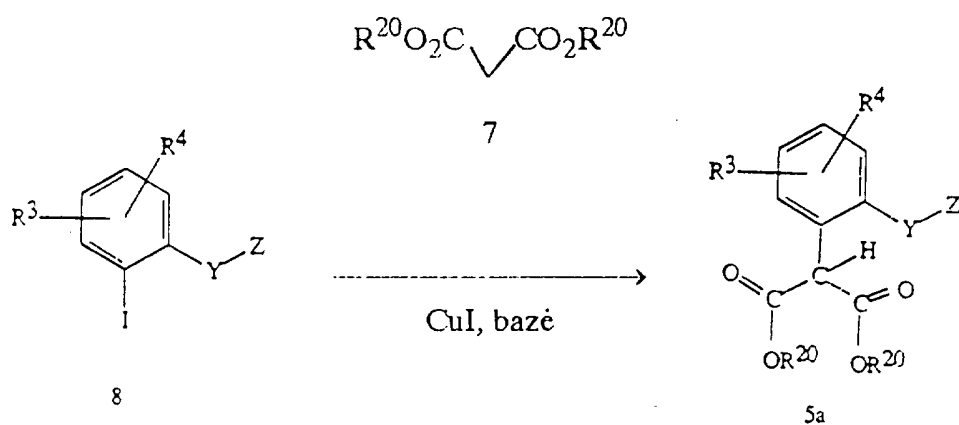
Kitos alkilavimo medžiagos, kurios gali perdirbti formulės 1 junginius į formulės I junginius, yra dialkilsulfatai, tokie kaip dimetilsulfatas, halogenalkilsulfonatai, tokie kaip metiltrifluormetansulfonatas, ir alkilhalogenidai, tokie kaip jodometanas ir propalgilbromidas (4 būdas). Šie alkilavimai gali būti atliekami su papildoma baze arba be papildomos bazės. Tinkamos bazės apima šarminio metalo alkoksidas, tokius kaip kalio tret-butoksidas, neorganines bazes, tokias kaip natrio hidridas ir kalio karbonatas arba tretinius aminorius, tokius kaip trietilaminas, piridinas, 1,8-diazabiciklo[5.4.0]-undek-7-anas (DBU) ir trietilendiaminas. Alkilavimo pavyzdžiams naudojamos tokio tipo medžiagos, žiūrėti R. E. Benson, T. L. Cairns, *J. Am. Chem. Soc.*, (1948), 70, 2115.

Formulės 1a junginiai (formulės 1 junginiai, kuriuose $G=C$, $W=O$ ir $X=OH$) gali būti paruošti kondensuojant formulės 5 malonatus arba malonatų darinius su formulės 6 (2 schema) tinkamais nukleofiliniais reagentais. Formulės 6 nukleofiliniai reagentai yra N-pakeisti hidroksilaminai (HO-NHR^2) ir pakeisti hidrazinai ($\text{HN(R}^5\text{)-NHR}^2$). Tokių nukleofilinių reagentų pavyzdžiai yra N-metilhidroksilaminas ir metilhidrazinas. Formulės 5 malonato esteriai gali būti paruošti žemiau aprašytais būdais. Formulės 5 esteriai taip pat gali būti aktyvuoti iš pradžių hidrolizinant esterį, sudarant atitinkamą rūgštį, ir po to paverčiant rūgštį į rūgšties chloranhidridą ($T=\text{Cl}$), naudojant tionilchloridą arba oksalilchloridą arba į acilimidazolą ($T=1\text{-imidazolilas}$), apdorojant 1,1'-karbonildiimidazolu.

2 schema

T = O(C₁-C₄-alkilas), Cl, 1-imidazolilas

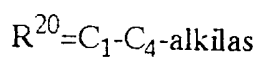
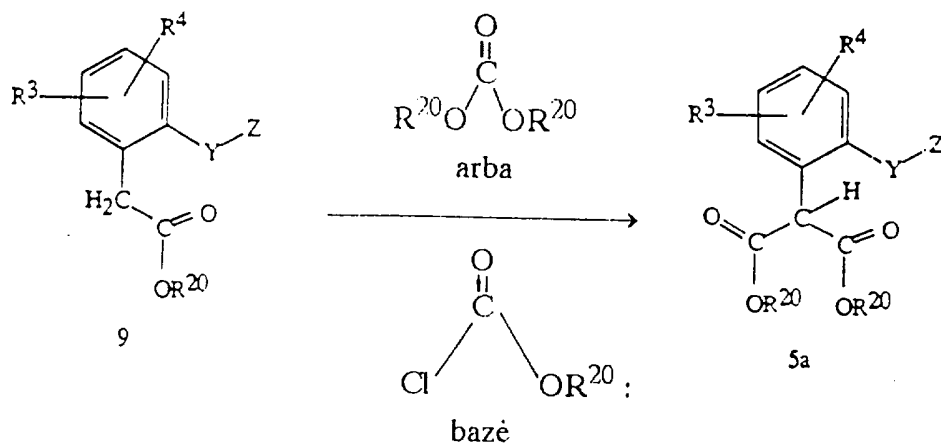
Formulės 5a esteriai gali būti paruošti formulės 7 malonato esterių variu (I)-katalizuojamoje reakcijoje su tinkamais formulės 8 jodobenzenais A. Osuka, T. Kobayashi and H. Suzuki, *Synthesis*, (1983), 67 aprašytas būdais ir pavaizduota 3 schemoje.

3 schema

R²⁰ = C₁-C₄-alkilas

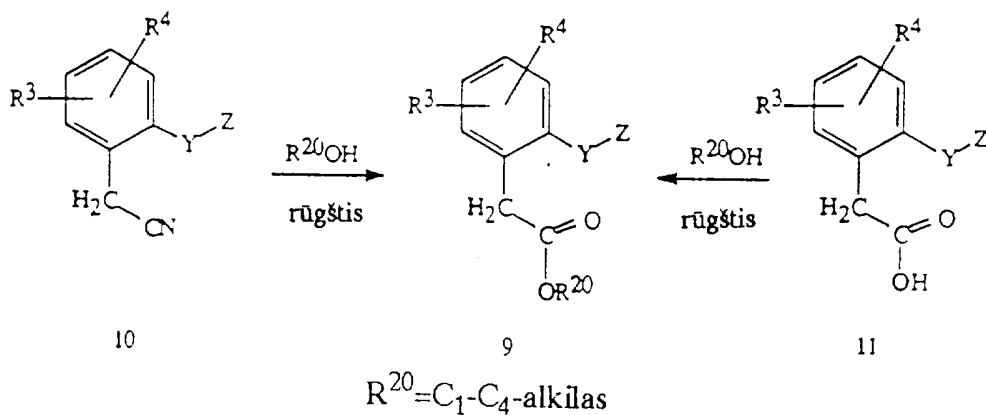
Be to, formulės 5a malonato esteriai gali būti paruošti formulės 9 fenilacto rūgšties esterius apdorojant dialkilkarbonatu dalyvaujant tinkamai bazei, tokiai kaip, bet neapsiribojant vien ja, metalinis natrijs ir natrio hidridas (4 schema). Pavyzdžiui, žiūrėti *J. Am Chem. Soc.*, (1928), 50, 2758.

4 schema

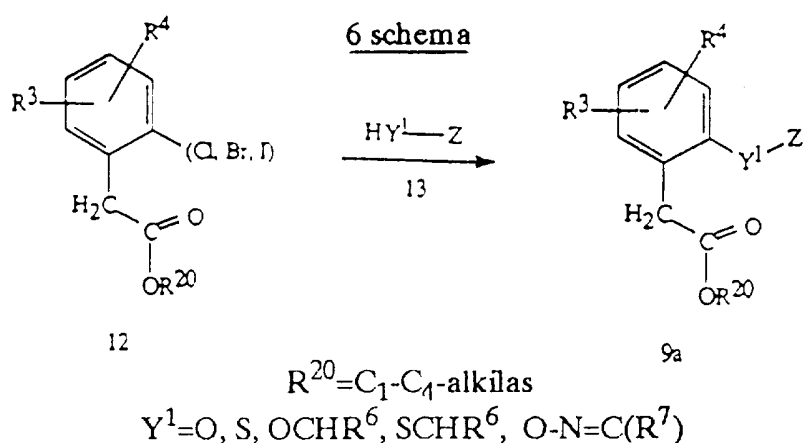


Formulės 9 esteriai gali būti paruošti formulės 10 fenil/acetonitrilo alkoholizės reakcijoje katalizuojamoje rūgštimi arba esterinant formulės 11 fenilacto rūgštį, kaip parodyta 5 schemeje (žiūrėti *Org. Synth.*, Vol. I, (1941), 270).

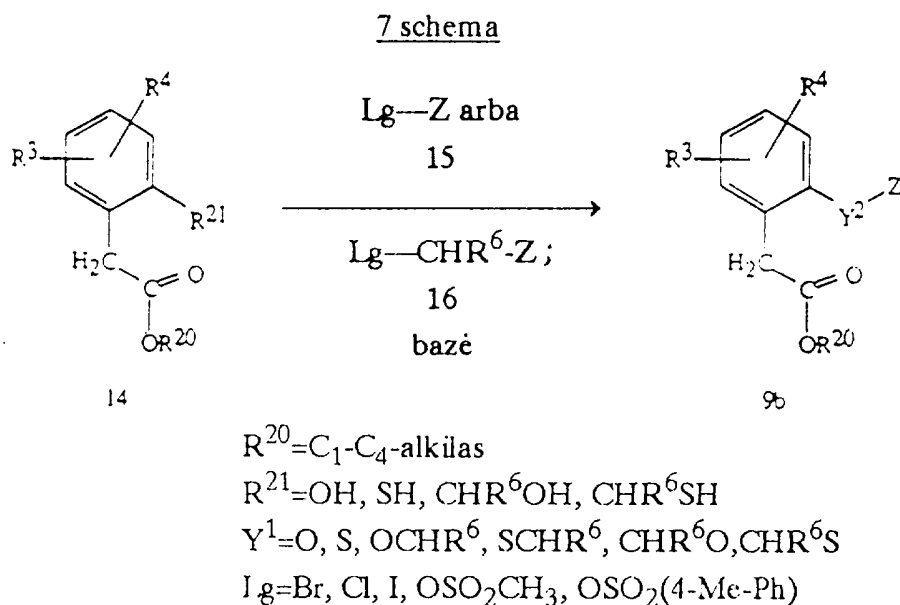
5 schema



Formulės 9 fenilacto rūgšties esteriai taip pat gali būti paruošti variu (I)-katalizuojamoje formulės 12 fenil/halogenido kondensacijos su formulės 13 junginiais reakcijoje, kaip aprašyta EP-A-307 103 ir parodyta toliau pateiktoje 6 schemeje.

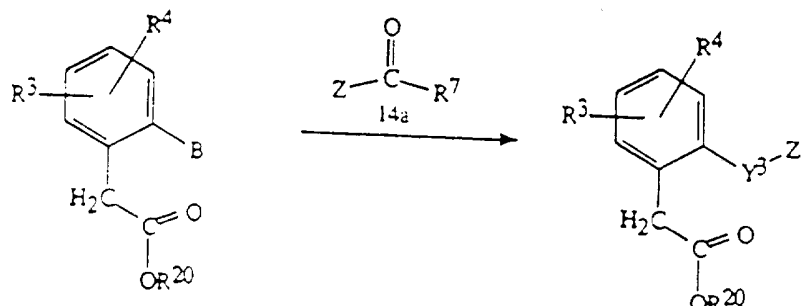


Kai kurie formulės 9 (formulės 9b) esteriai taip pat gali būti paruošti formuojant Y^2 tiltelį, naudojant įprastą nukleofilinio pavadavimo reakciją (7 schema). Atitinkamos atskylančios grupės (Lg) formulės 15 ar 16 elektrofiluose pakeitimas formulės 14 nukleofiliniu esteriu duoda formulės 9b junginius. Bazė, pavyzdžiui natrio hidridas, yra naudojama gaminti formulės 14 junginiui, atitinkamai alkoksidui arba tioalkoksidui.



Kai kurie formulės 9 (formulės 9e) esteriai tai pat gali būti paruošti formuojant Y^3 tiltelį iš pakeisto formulės 9d hidroksilamino ir formulės 14a karbonilo junginių. Formulės 9a hidroksilaminas yra savo ruožtu paruoštas iš formulės 9c esterių. Šis būdas buvo aprašytas EP-600 835 ir toliau pavaizduotas 8 schemeje.

8 schema

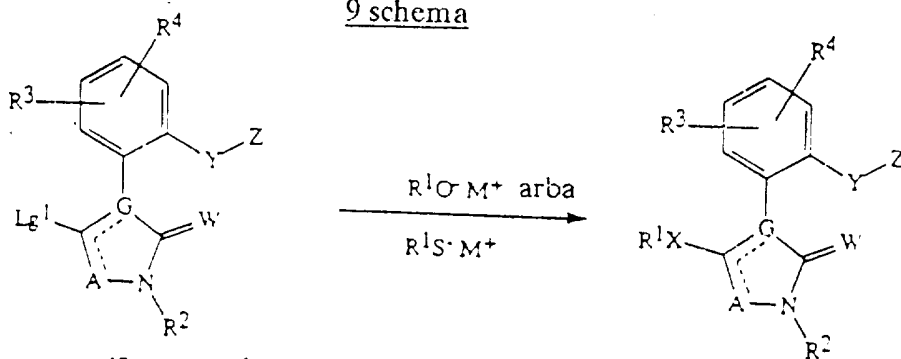
9c B=CHR⁶Br9d B=CHR⁶ONH₂HClR²⁰=C₁-C₄-alkilasY³=CHR⁶ON=C(R⁷)

9

2) Mainų ir prisijungimo/atskėlimo reakcijos

Formulės I junginiai taip pat gali būti gauti formulės 17 junginiams reaguojant su šarminio metalo alkoksida ($R^1 O^- M^+$) arba šarminio metalo tioalkoksida ($R^1 S^- M^+$) tinkamame tirpiklyje (9 schema). Formulės 17 amidų paliekančioji grupė Lg¹ yra bet kuri grupė, tinkama tokios rūšies pakeitimo reakcijai. Tinkamų paliekančiųjų grupių pavyzdžiai apima chlorą, bromą ir sulfonilo ir sulfonato grupes. Tinkamų inertinių tirpiklių pavyzdžiais yra dimetilformamidas ir dimetilsulfoksidas.

9 schema



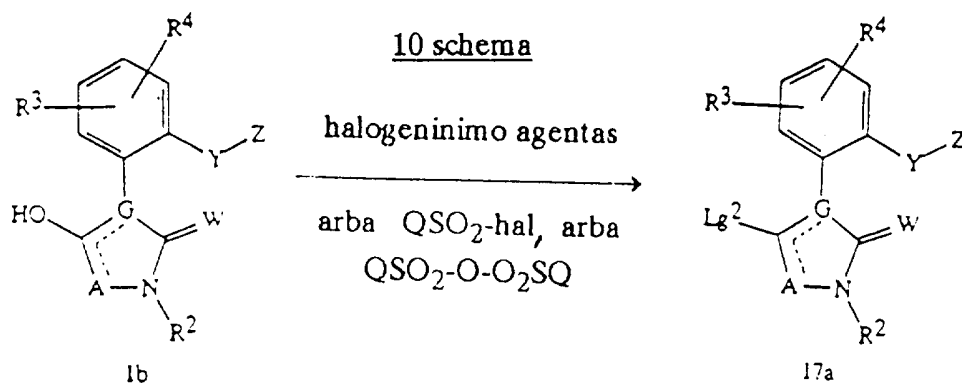
17

Lg¹= Cl, Br, -SO₂Q, arba -OSO₂QQ=C₁-C₄-alkilas arba C₁-C₄-halogenalkilas

M=K arba Na

I

Formulės 17a junginiai gali būti gauti formulės 16 junginiams (formulės I junginiai, kuriuose X yra OH) reaguojant su halogeninimo agentais, tokiais kaip tionilchloridas arba fosforo oksibromidas, suformuojant atitinkamą β-halogenpakeistus darinius (10 schema). Priešingai, formulės 1b junginiai gali būti apdorojami alkilsulfonilo halogenidu arba halogenalkilsulfonilo anhidridu, tokiu kaip metansulfonilchloridas, p-toluensulfonilchloridas ir trifluorometansulfonilanhidridas, suformuoja atitinkamą formulės 17a β-alkilsulfonata. Reakcija su sulfonilhalogenidais gali būti atlikta dalyvaujant tinkamai bazei (pavyzdžiui, trietilaminui).

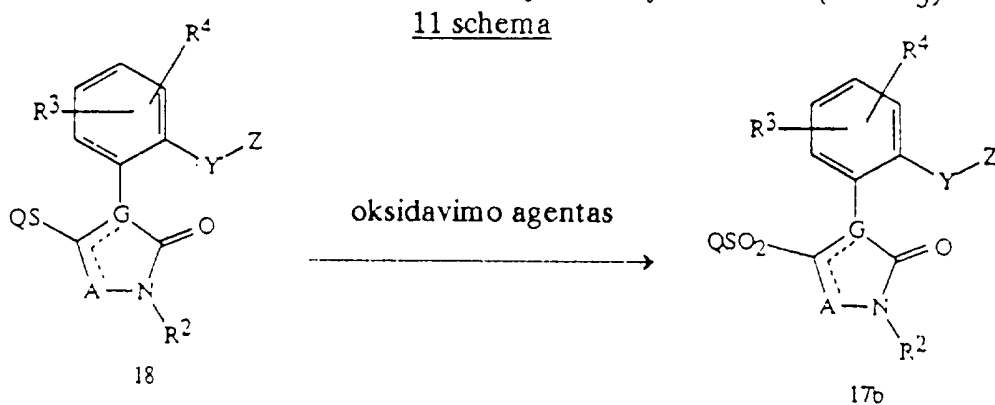


$Lg^2 = Cl, Br, \text{ arba } -OSO_2Q$

$Q = C_1-C_6\text{-alkilas arba } C_1-C_6\text{-halogenalkilas}$

hal = Br, Cl arba F

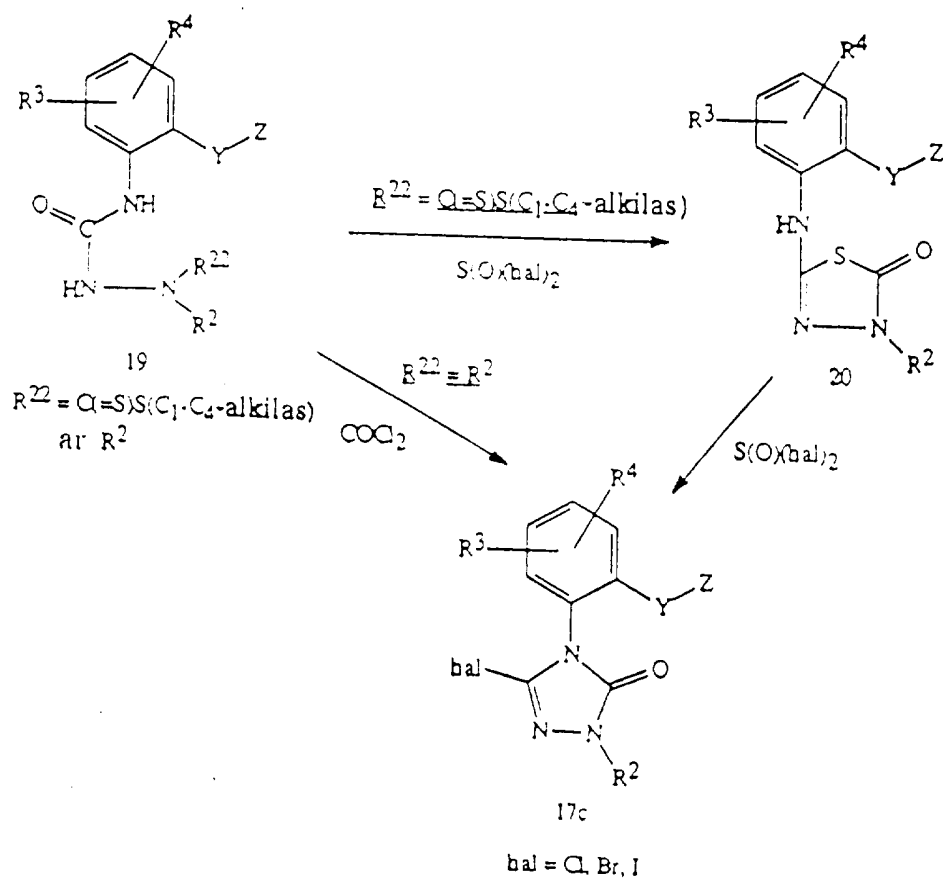
Kaip parodyta 11 schemeje formulės 17b sulfonilo junginiai gali būti paruošti oksiduojant formulės 18 atitinkamus tio junginius, naudojant gerai žinomus sieros oksidacijos būdus (žiūrėti Schrenk, K. *The Chemistry of Sulphones and Sulphoxides*; Patai, S. et al., Eds.; Wiley: New York, 1988). Tinkami oksidacijos reagentai apima meta-chlor-peroksibenzoinę rūgštį, vandenilio peroksidą ir Oxone[®] (KHSO₅).



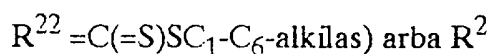
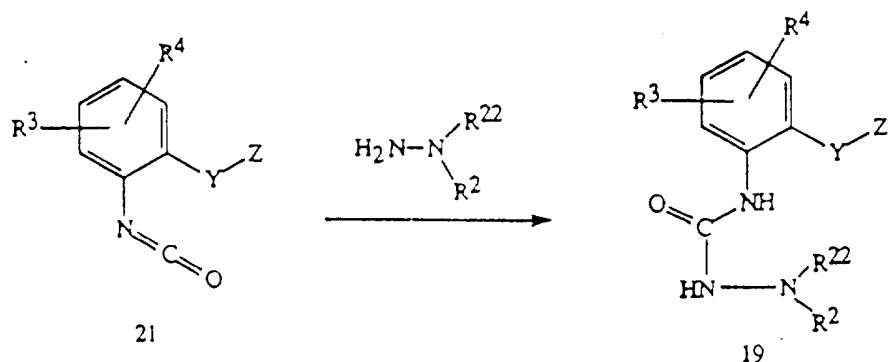
$Q = C_1-C_6\text{-alkilas arba } C_1-C_6\text{-halogenalkilas}$

Priešingai, formulės 17a halogen-junginiai (formulės 17a junginiai, kur $A = N$, $G = N$ ir $W = O$) gali būti paruošti iš formulės 19 hidrazidų, kaip parodyta 12 schemeje. Kai $R^2 = C(=S)S(C_1-C_6\text{-alkilas})$, formulės 19 diacilo junginys yra apdorojamas tionilhalogenidu su pertekliumi, pavyzdžiui, tionilchloridu su pertekliumi. Pirmiausiai susidarantis produktas yra formulės 20 uždaro ciklo junginys, kuris gali būti izoliuotas arba perdirbtas *in situ* į formulės 17c junginį; šio proceso aprašymą žiūrėti P. Molina, A. Tarraga, A. Espinosa, *Syntesis*, (1989), 923.

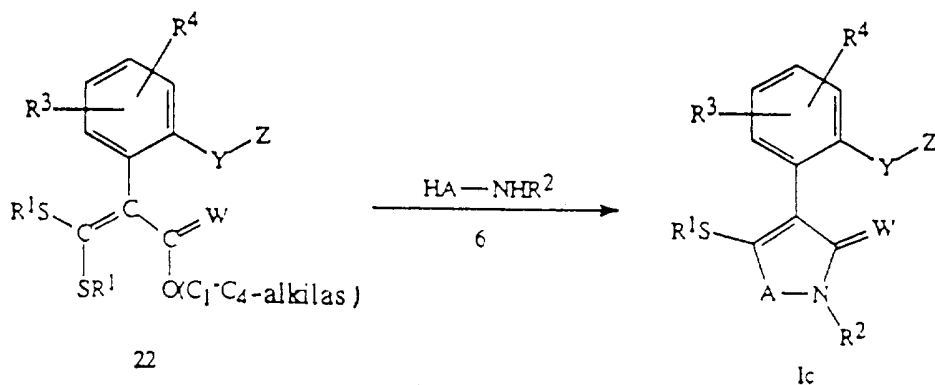
Priešingai, kai $R^{22} = R^2$ kaip apibrėžta aukščiau, formulės 19 hidrazidas yra ciklintas fosgenu, sudarant formulės 17c ciklinį karbamidą, kur hal = Cl. Šis procesas išsamiai aprašytas *J. Org. Chem.*, (1989), 54, 1048.

12 schema

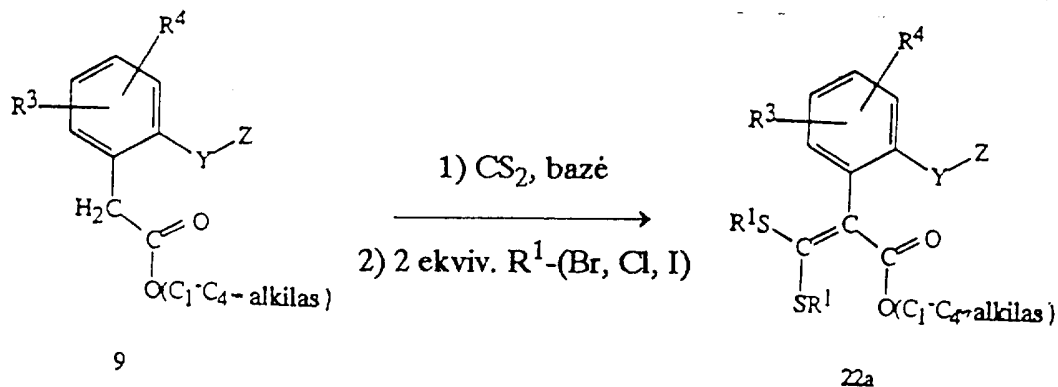
Formulės 19 hidrazidai gali būti paruošti kaip parodyta 13 schemeje. Formulės 21 izocianato kondensacija su formulės $\text{H}_2\text{NNR}^2\text{R}^{22}$ hidrazinu inertiniame tirpiklyje, tokiame kaip tetrahidrofuranas, duoda hidrazidą.

13 schema3) Prisijungimo/ciklizacijos reakcijos

Papildant aukščiau aprašytus būdus, formulės I junginiai, kuriuose $\text{X}=\text{SR}^1$ ir $\text{G}=\text{C}$ (formulė I), gali būti paruošti apdorojant formulės 22 keteno ditioacetalį tinkamu formulės 6 (14 schema) nukleofiliniu reagentu. Formulės 16 nukleofilinis reagentas yra aprašytas aukščiau.

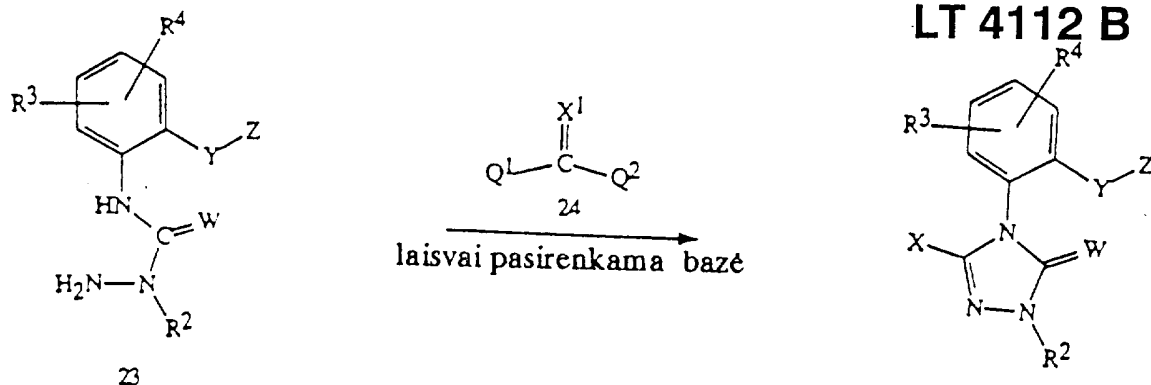
14 schema

Formulės 22a keteno ditioacetaliai gali būti paruošti kondensuojant formulės 9 fenilacto rūgšties esterius su anglies disulfidu dalyvaujant tinkamai bazei, toliau reaguojant su dviem R^1 -halogenido ekvivalentais, tokiais kaip jodometanas arba propargilo bromidas (15 schema).

15 schema

Formulės 1a junginiai (formulės 1 junginiai, kai A=N, G=N) gali būti paruošti formulės 23 N-aminourėją kondensuojant su formulės 24 (16 schema) karbonilinimo agentu. Formulės 24 karbonilinimo agentais yra karbonilą arba tiokarbonilą perduodantys reagentai, tokie kaip fosgenas, tiofosgenas, difosgenas (ClC(=O)OCCl₃), trifosgenas (Cl₃COC(=O)OCCl₃), N,N'-karbonildiimidazolas, N,N'-tiokarbonildiimidazolas ir 1,1-karbonildi(1,2,4-triazolas). Priešingai, formulės 24 junginiai gali būti alkilchlorformiatų arba dialkilkarbonatų. Kai kurioms šių karbonilinimo reakcijų reakcijos vykdymui gali reikėti papildomos bazės. Tinkamos bazės apima šarminių metalų alkoksidas, tokius kaip kalio tret-butoksidas, neorganines bazes, tokias kaip natrio hidridas ir kalio karbonatas arba tretinius aminus, tokius kaip tretilaminas, piridinas, 1,8-diazoliciklo[5.4.0]-undek-7-onas (DBU) arba trietilendiaminas. Tinkami tirpikliai apima polinius aprotoninius tirpiklius, tokius kaip acetonitrilas, dimetilformamidas, dimetilsulfoksidas; eterius, tokius kaip tetrahidrofuranas, dimetoksietanas arba dietileteris; ketonus, tokius kaip acetonas arba 2-butanonas; angliavandenilius, tokius kaip toluenas arba benzenas; arba perhalogenangliavandenilius, tokius kaip dichlormetanas arba trichlormetanas. Reakcijos temperatūra gali svyruoti nuo 0°C iki 150° C ir reakcijos trukmė gali būti nuo 1 iki 72 valandų, priklausomai nuo pasirinktos bazės, tirpiklio, temperatūros ir substrato.

16 schema



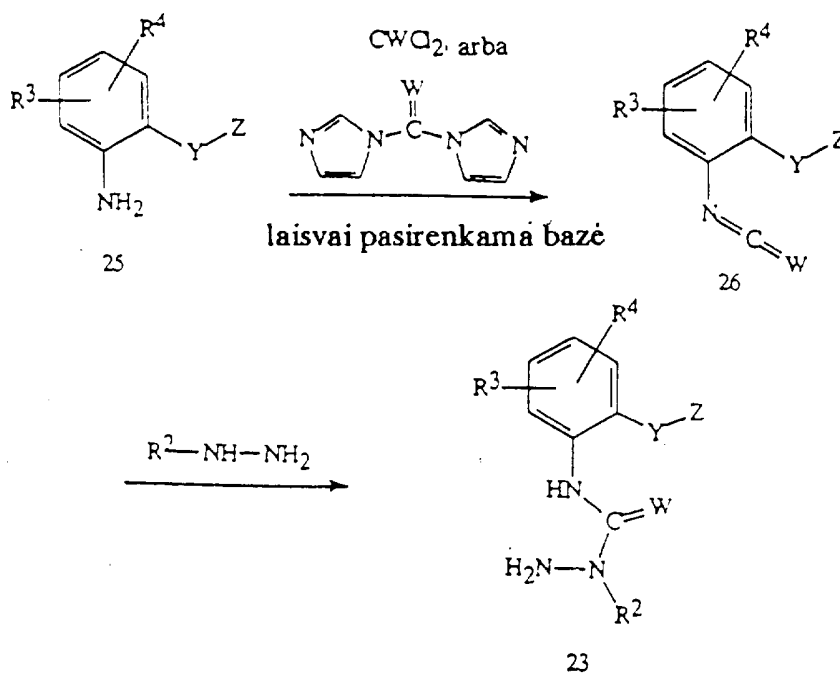
Q^1 ir Q^2 nepriklausomai yra Cl, $OCCl_3$, $O(C_1-C_4\text{-alkilas})$,
1-imidazolilas, 1,2,4-triazolilas

$X = OH$ arba SH

$X^1 = O$ arba S

Formulės 23 N,N^1 -aminourėja gali būti paruošta kaip parodyta 17 schemeje. Apdorojant formulės 23 aniliną fosgenu, tiofosgenu, N,N' -karbonildiimidazolu arba N,N' -tiokarbonildiimidazolu gaunamas formulės 26 izocianatas arba izotiocianatas. Reakcijai su fosgenu arba tiofosgenu gali būti pridėta bazė. Toliau izo(tio)cianatą apdorojant R^2 -pakeistu hidrazinu duoda formulės 23 N -aminourėją.

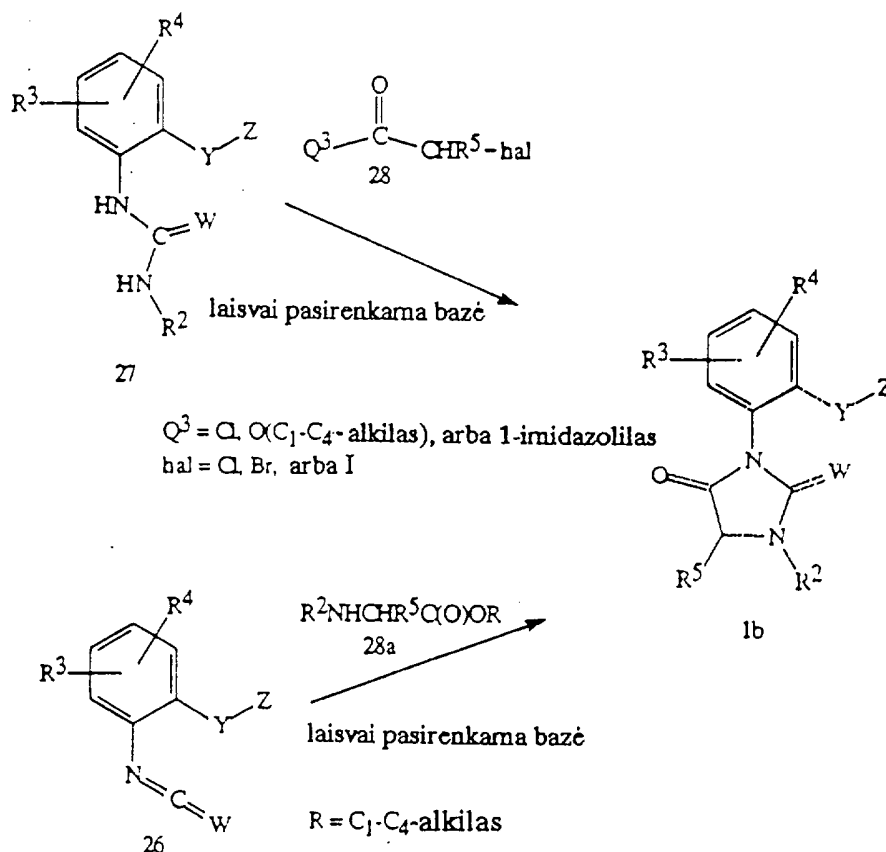
17 schema



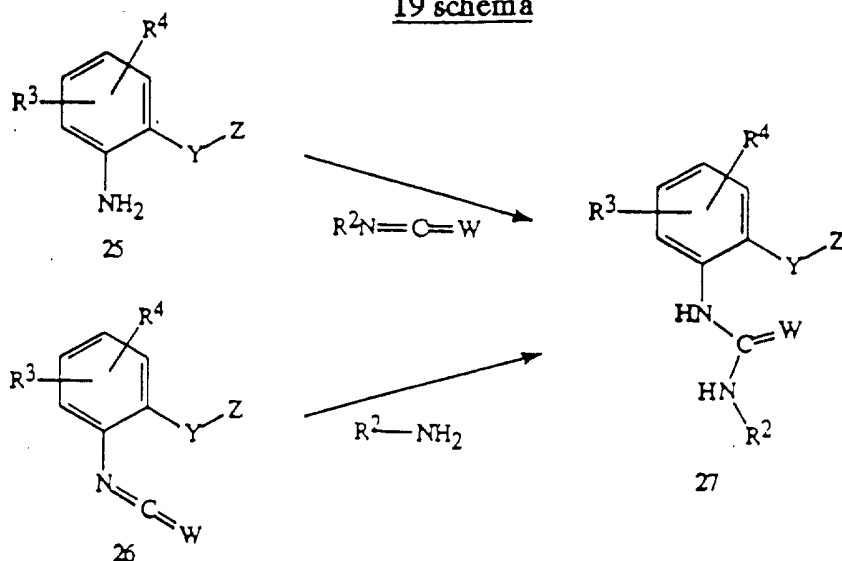
Formulės 1 b junginiai (formulės 1 junginiai, kur $A=CR^2$, $G = N$ ir $N=O$) gali būti paruošti taip pat 18 schemeje parodytu būdu. Formulės 27 karbamidas reaguoja su aktyvuotos 2-halogenkarboksirūgšties dariniais, tokiais kaip 2-halogenkarboksirūgšties chloranhidridas, 2-halogenkarboksirūgšties esteriai arba 2-halogenacilimidazolai. Pradinį anilino azoto acilinimą toliau seka intramolekulinis 2-halogengrupės pakeitimas ir įvyksta ciklizacija. Paspirtinti acilinimą ir/arba vėliau vykstančią ciklizaciją gali būti pridėta bazė. Tinkamos bazės apima trietilaminą ir

natrio hidridą. Priešingai, formulės 1b junginiai gali būti gauti formulės 26 izocianatams reaguojant su formulės 28a esteriais. Kaip aprašyta aukščiau, bazė gali būti pridėta reakcijai pagreitinanti ir vėlesnei formulės 1b junginių ciklizacijai.

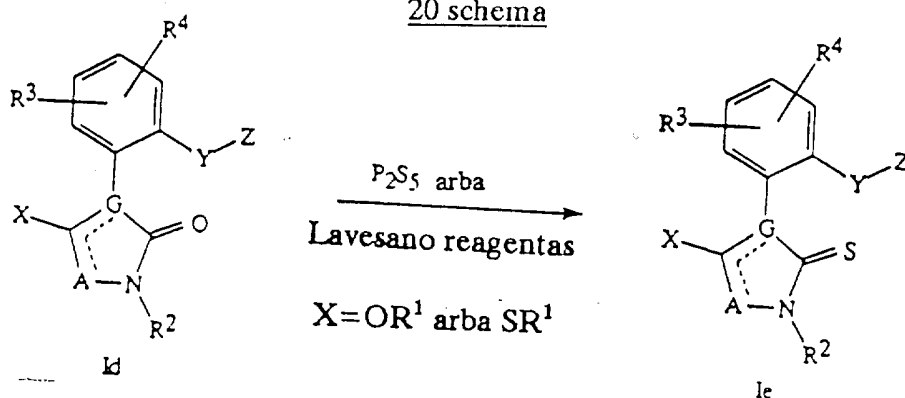
18 schema



Formulės 27 karbamidai gali būti paruošti 19 scheme pavaizduotais būdais. Formulės 25 anilinai gali susijungti su formulės $R^2N=C=W$ izocianatais arba izotiocianatais, kaip aprašyta aukščiau. Priešingai, formulės 26 izocianatai arba izotiocianatai gali būti kondensuoti su formulės R^2-NH_2 aminais sudarant karbamidą. Formulių 25 ir 26 anilinais ir izo(tio)cianatais atitinkamai yra prekyboje žinomi arba paruošiami gerai žinomais būdais. Pavyzdžiui, izotiocianatas gali būti paruoštas *J. Heterocycl. Chem.*, (1990), 27, 407 aprašytais būdais. Izocianatai gali būti paruošti kaip aprašyta March, J. *Advanced Organic Chemistry*; John Wiley: New York, (1985), pp 944, 1166.

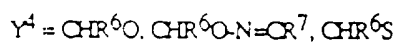
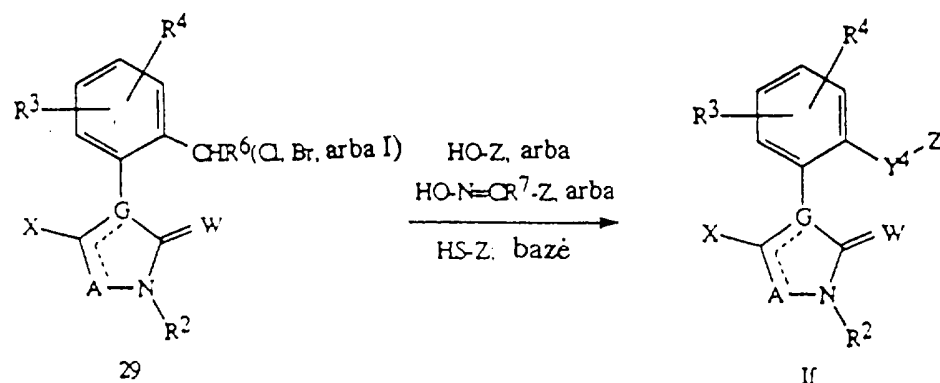
19 schema4) Sulfidinimas

Formulės Ie junginiai, formulės I, kurioje $W=S$, junginiai gali būti gauti apdorojant formulės Id (formulės I, kurioje $W=O$) junginius sulfidinimo reagentais, tokiais kaip P_2S_5 arba Lavesano (Lawesson's) reagentu [2,4-bis(4-metoksifenil)-1,3-ditio-2,4-difosfenoliato-2,4-disulfidu], kaip parodyta 20 schemeje (žiūrėti *Bull. Soc. Chim. Belg.*, (1978), 87, 229; ir *Tetrahedron Lett.*, (1983), 24, 3815).

20 schema5) Arilo dalies sintezė

Formulės If junginiai (formulės I, kurioje Y yra CHR^6O , CHR^6S arba $CHR^6O-N=CR^7$) junginiai gali būti paruošti jungiantis formulės 29 halogenidams su įvairiais nukleofiliniais reagentais (21 schema). Tinkamas alkoholis arba tiolas yra apdorojamas baze, pavyzdžiui, natrio hidridu, gaunant atitinkamą alkoksidą arba tioalkoksidą, kuris veikia kaip nukleofilinis reagentas.

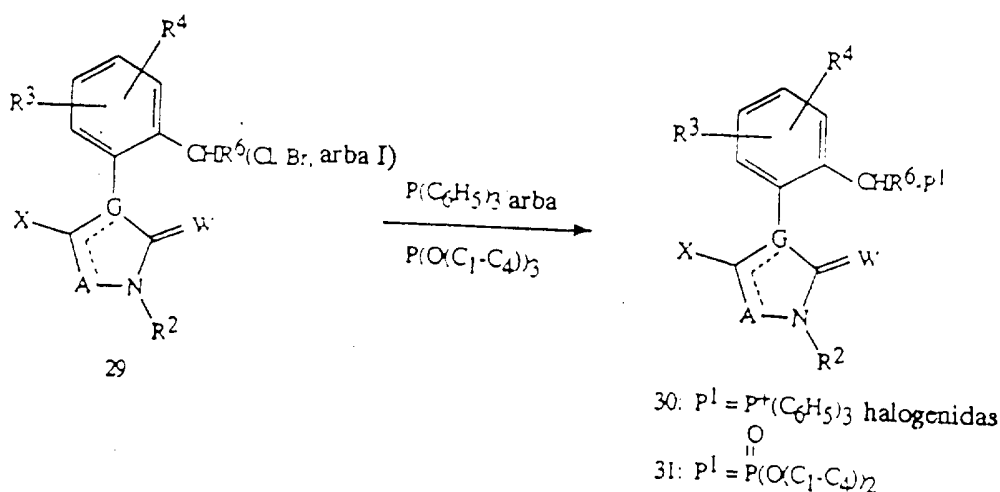
21 schema

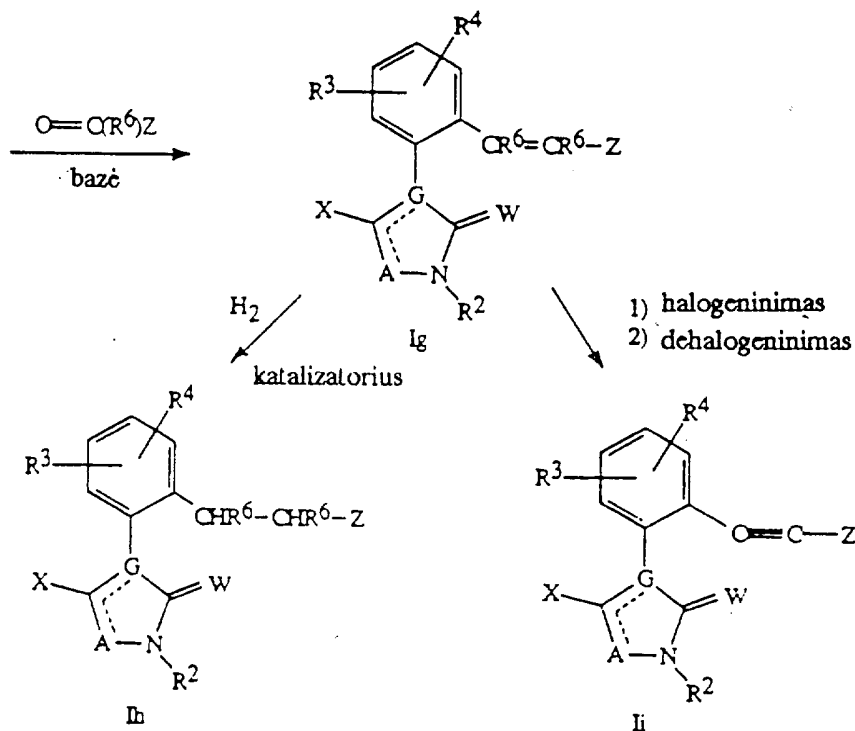


Formulės 29 benzil/halogenidai gali būti paruošti atitinkamo alkilo junginio, t.y. formulėje 29 H vietoje halogeno, radikaliniu halogeninimu arba atitinkama metileterį (t.y. formulėje 29 OMe vietoje halogeno) skaldant rūgštimi.

Formulės I, kurioje Y yra $\text{CR}^6=\text{CR}^6$ ir $\text{CHR}^6-\text{CHR}^6$ (formulė Ig ir formulė Ih, atitinkamai), junginiai gali būti paruošti kaip parodyta 22 schemeje. Apdorojant formulės 29 benzil/halogenidus trifenilfosfinu arba trialkilfosfitu gaunamos atitinkamos fosfonio druskos (formulė 30) arba fosfonatai (formulė 31), atitinkamai. Fosforo junginio kondensavimas su baze ir formulės $\text{Z}(\text{R}^6)\text{C}=\text{O}$ karbonilo junginiu duoda formulės Ig olefiną.

22 schema



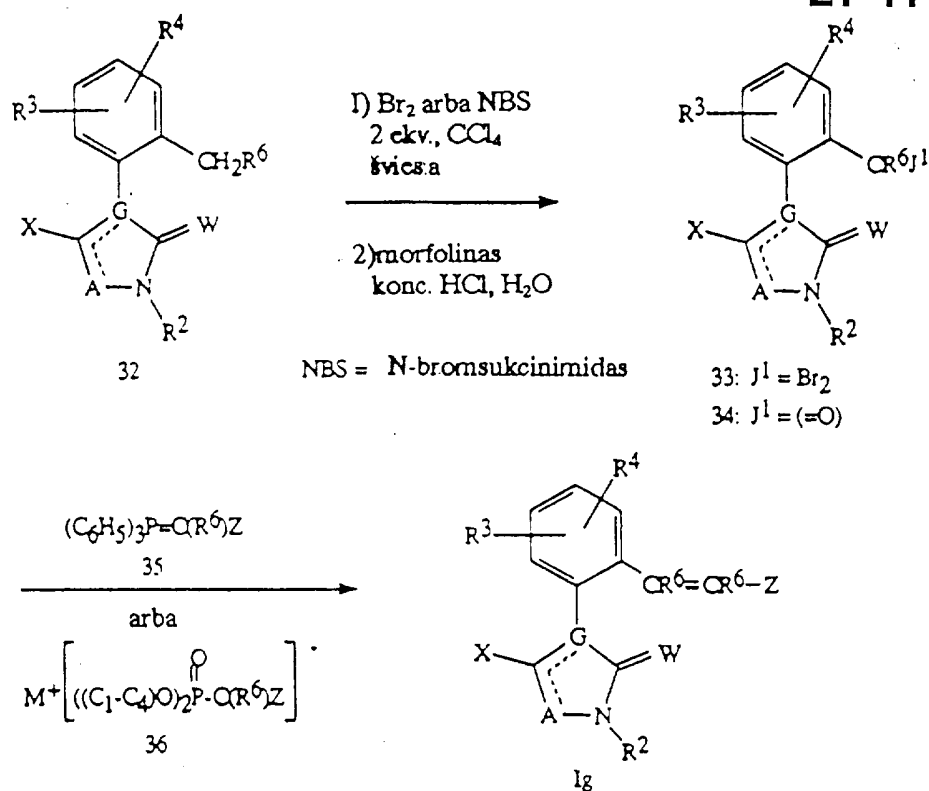


Formulės Ig definai gali būti perdirbti į sočiuosius formulės Ih junginius hidrinant per metalo katalizatorių (tokį kaip paladis arba anglis), kaip gerai žinoma mokslui (Rylander, *Catalytic Hydrogenation in Organic Synthesis*; Academic: New York, 1979).

Formulės Ii alkinai gali būti paruošti halogeninant/dehalogeninant formulės Ig olefinus, naudojant mokslui gerai žinomas operacijas (March, J. *Advanced Organic Chemistry*; 3rd ed., John Wiley: New York, (1985), p 924). Be to, formulės Ii alkinai gali būti paruošti gerai žinoma aromatinių halogenidų reakcija su alkinų dariniais, dalyvaujant katalizatoriui, tokiam kaip nikelis ar paladis (žiūrėti J. *Organomet. Chem.*, (1975), 93, 253-257).

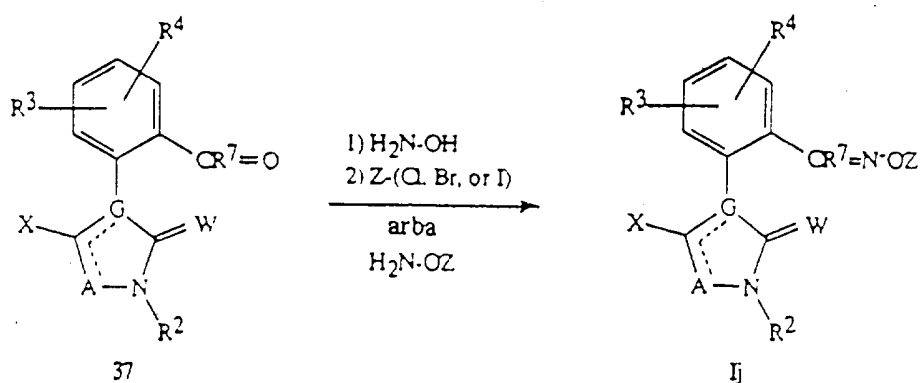
Formulės Ig olefinas taip pat gali būti paruoštas pakeičiant reagentų reakcijos gebą Vitigo (Wittig) arba Hornerio-Emonso (Horner-Emmons) kondensacija. Pavyzdžiui, formulės 31 2-alkilfenilo dariniai gali būti pakeisti į atitinkamą formulės 33 dibromo junginį kaip parodyta 23 scheme (žiūrėti *Synthesis*, (1988), 330). Dibromo junginys gali būti hidrolizintas į formulės 34 karbonilo junginį, kuris savo ruožtu gali būti kondensuotas su formulės 35 arba 36 fosforo turinčiais nukleofiliniais reagentais, gaunant formulės Ig olefiną.

23 schema



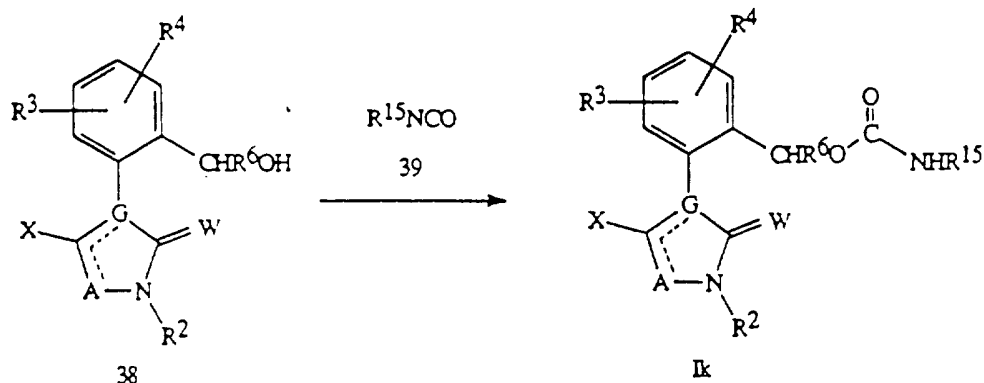
Formulės Ij (formulė I, kurioje Y yra $C(R^7)=N-O$) oksimai gali būti paruošti formulės 37 karbonilo junginius kondensuojant su hidroksilaminu, toliau O-alkilinant formulės Z-(Cl, Br arba I) elektrofilais (24 schema). Priešingai, O-pakeisti hidroksilaminai gali būti kondensuoti su formulės 37 karbonilo junginiu, tiesiogiai gaunant formulės Ij oksimus.

24 schema



Formulės Ik karbamatai gali būti paruošti reaguojant formulės 38 benzil-alkoholiams su formulės 39 izocianatais (25 schema). Reakcijai katalizuoti gali būti pridėdama bazė, tokia kaip trietilaminas.

25 schema



Toliau pateikti pavyzdžiai vaizduoja naujų formulės I ciklinių amidų gamybą. Žemiau pateiktame ^1H BMR spektre poslinkiai yra m.d. nuo tetrametilsilano: s = singletas, d = dubletas, t = tripletas, dt = dvigubas tripletas, td = trigubas dubletas, m = multipletas.

1 PAVYZDYS

A stadija: Metil-2-(3-metoksifenoksi)fenilacetato gavimas

(2-chlorfenil)acto rūgšties (60 g), 3-metoksifenolio (87 g), kalio karbonato (97,2 g) ir vario (I) chlorido (0,6 g) buvo sujungta ir mechaniškai sumaišyta gaunant tirštą rudą suspensiją. Suspensija buvo kaitinama 4,5 val., po to atvėsinta iki 70°C ir buvo pridėta 10 ml N,N-dimetilformamido. Mišinys buvo supiltas į ledinį vandenį ir parūgštintas koncentruota vandenine HCl. Mišinys buvo ekstrahuotas dietilo eteriu ir sujungti ekstraktai buvo praplauti vandeniu (4 kartus) išdžiovinti (MgSO_4), filtruoti ir koncentruoti sumažintame slėgyje, gaunant 122 g alyvos. Nevalyta medžiaga buvo ištirpdyta 73 ml metanolio ir po to pridėta 2,1 ml koncentruotos sieros rūgšties. Mišinys buvo kaitinamas 4 val. kolboje su grįžtamuoju šaldytuvu. Mišinys buvo išpiltas į ledinį vandenį ir ekstrahuotas dietilo eteriu. Sujungta organinė fazė buvo praplauta 10 % vandeniniu NaOH tirpalu (2 kartus), po to vandeniu (4 kartus), po to sūrymu. Organinė fazė buvo išdžiovinta (MgSO_4), filtruota ir koncentruota sumažintame slėgyje, išeiga 46,4 g (48%) A stadijos pavadinime nurodytos medžiagos, kaip rausvos alyvos.

^1H BMR(CDCl_3): δ 6.45-7.4 (m, 8H), 3.78 (s, 3H), 3.69 (s, 2H), 3.62 (s, 3H).

B stadija: Dimetil[2-(3-metoksifenoksi)fenil]propandioato gavimas

Metil-2-(3-metoksifenoksi)fenilacetatas (6,81 g) buvo ištirpintas 11 ml dimetilkarbonato ir pridėta 600 mg natrio. Mišinys buvo kaitinamas kolboje su grįžtamuoju šaldytuvu 10 val., po to atvėsintas. Reakcijos mišinys buvo atšaldytas vandeniu, parūgštintas koncentruota vandenine HCl ir ekstrahuotas dichlormetanu. Sujungti organiniai ekstraktai buvo išdžiovinti (MgSO_4), filtruoti ir koncentruoti sumažintame slėgyje pridėdant alyvos. Norima medžiaga buvo atskirta iš nesureagavusios pradinės medžiagos aukšto slėgio adsorbicine staigia chromatografija (flasch chromatography) (4:1 heksanas:etilacetatas, kaip eliuentas), išeiga po koncentracijos - 3,54 g (43 %) B stadijos antraštėje nurodyto junginio.

^1H BMR(CDCl_3): δ 7.46 (dd, $J = 1.5, 7.5\text{Hz}$, 1H), 7.29 (t, $J = 8\text{Hz}$, 1H), 7.2 (m, 2H), 6.92 (d, $J = 8\text{Hz}$, 1H), 6.65 (td, $J = 1.5, 7.5\text{Hz}$, 1H), 6.5 (m, 2H), 5.14 (s, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.73 (s, 6H).

C stadija: 5-Hidroksi-4-[2-(3-metoksifenoksi)fenil]-2-metil-3(2H)-izoksazolono gavimas

N-Metilhidroksilamino hidrochloridas (2,79 g) buvo ištirpinta 20 ml metanolio šildant kolboje su grįžtamuoju šaldytuvu. Tirpalas buvo atvėsintas ir apdorotas 3,76 g natrio hidrido tirpalu 15 ml metanolio. Kalio chlorido nuosėdos buvo pašalintos filtruojant ir lašais pridėta 3,54 g dimetil[2-(3-metoksifenoksi)fenil]propaodioato tirpalo 25 ml metanolio. Mišinys buvo maišomas per naktį kambario temperatūroje. Reakcijos mišinys buvo kondensuotas vakuume iki maždaug 30 ml ir parūgštintas koncentruota HCl atšaldant. Tirpikliai buvo pašalinti sumažintame slėgyje ir nuosėdos paskirstytos tarp vandens ir dichlormetano. Sujungtos organinės fazės buvo išdžiovintos (MgSO_4), filtruotos ir koncentruotos sumažintame slėgyje, išeiga 2,95 (88 %) C stadijos antraštėje nurodyto junginio.

^1H BMR(CDCl_3): δ 7.2-7.4 (m, 3H), 7.12 (dt, $J = 1, 7.5\text{Hz}$, 1H), 6.81 (d, $J = 8.5\text{Hz}$, 1H), 6.72 (d, $J = 8\text{Hz}$, 1H), 6.6 (m, 2H), 4.43 (s, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.28 (s, 3H).

D stadija: 5-Metoksi-4-[2-(3-metoksifenoksi)fenil]-2-metil-3(2H)-izoksazolono gavimas

5-Hidroksi-4-[2-(3-metoksifenoksi)fenil]-2-metil-3(2H)-izoksazolonas (2,5 g) buvo ištirpintas 3 ml metanolio ir 15 ml tolueno ir tšaldytas ledo vonioje. Trimetilsilildiazometanas (5 ml 2.0 M tirpalo heksane) buvo lašais pridėtas. Buvo pastebimas dujų išsiskyrimas. Gautas geltonas tirpalas buvo maišomas per naktį kambario temperatūroje. Tirpikliai buvo pašalinti sumažintame slėgyje ir nuosėdos buvo grynintos impulsine chromatografija (1:1 heksanas:etilacetatas, kaip eliuentas). Kitas praplovimo komponentas buvo parinktas, kad gauti 950 mg (36 %) D stadijos antraštėje nurodyto junginio.

^1H BMR(CDCl_3): δ 7.51 (dd, $J = 1.7, 7.5\text{Hz}$, 1H), 7.27 (dt, $J = 1.7, 7.5\text{Hz}$, 1H), 7.17 (m, 2H), 6.97 (dd, $J = 1, 8\text{Hz}$, 1H), 6.5 (m, 3H), 3.92 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.33 (s, 3H).

2 PAVYZDYS

A stadija: 1-(Bromometil)-2-jodobenzeno gavimas

I 2-jodobenziletanolio (50 g) tirpalą dietileteryje (500 ml), atšaldytą ledo vonioje, buvo lašais pridėta fosforo tribromido (28 ml). Reakcijos mišinys 3,5 val. buvo šaldytas šaldytuve, po to atšaldyta palengva pridedant metanolio (50 ml). Mišinys buvo praplautas vandeniu, po to įsotintas natrio bikarbonatu, po to vandeniu (po 100 ml kiekvieno). Organinė fazė buvo išdžiovinta (MgSO_4), filtruota ir kondensuota sumažintame slėgyje iki baltų kristalų, kurie buvo sutrinti heksane ir

surinkti filtruojant, išeiga 58 g (91 %) kristalų A stadijos antraštėje nurodytos medžiagos, lyd. temp. 55-57°C.

B stadija: 1-Jodo-2-[(2-metilfenoksi)metil]benzeno gavimas

Natrio hidridas (60 % alyvos dispersija) (7,8 g) buvo porcijomis pridėta į ledo vandeniui atšaldytą *o*-krezolio (21,1 g) tirpalą tetrahidrofurane (500 ml). Mišinys buvo maišomas 20 minučių ir po to buvo pridėta 1-(bromometil)-2-jodobenzeno (58 g). Mišinys buvo šildomas 16 val. iki 60°C. Buvo pridėtas papildomas kalio hidridas (2 g) ir reakcijos mišinys kaitinamas papildomai dar 3 val. Reakcijos mišinys buvo atvėsintas ir atsargiai paveiktas vandeniui ir ekstrahuotas etilacetatu (2 x 250 ml). Sujungti organiniai ekstraktai buvo išdžiovinti (MgSO₄), filtruoti ir kondensuoti sumažintame slėgyje iki alyvos, kuri buvo ištrinta su šaltu heksanu, gaunant kristalus, kurie buvo surinkti filtruojant, išeiga 59,1 g (94 %) B stadijos pavadinime nurodytos medžiagos kaip baltų kristalų, lyd. temp. 106 - 108°C.

C stadija: Dimetil[2-[(2-metilfenoksi)metil]fenil]-propanedionato gavimas

Į natrio hidrido (60 % dispersija alyvoje) suspensiją (15,4 g) 90 ml 1,3-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2[1H]-pirimidinono (DMPU), atvėsinto ledo vandens vonioje, buvo pridėta lašais dimetilmalonato (44 ml) tirpalas DMPU (150 ml). Kai pridėjimas buvo baigtas, mišinys buvo maišomas 20 min. ir tada buvo pridėta 1-jodo-2-[(2-metilfenoksi)metil]-benzeno (62,5 g) ir vario jodido (73,3 g). Gautas mišinys buvo maišomas 100°C temperatūroje 5 val., tada maišoma per naktį 25°C temperatūroje. Mišinys buvo praskiestas 1N HCl (maždaug 150 ml) ir ekstrahuota dietileteriu (3x400 ml). Sujungti organiniai ekstraktai buvo išdžiovinti (MgSO₄), filtruoti ir kondensuoti sumažintame slėgyje iki pusiaukietos medžiagos, kuri buvo gryninta aukšto slėgio adsorbicine staigia chromatografija (flesch chromatography) silikagelyje (5:2 heksanas:etilacetatas, kaip eliuentas). Pagrindinė medžiaga buvo surinkta filtruojant, išeiga 56,9 g (79 %) C stadijos antraštėje nurodyto junginio kaip baltų kristalų, lyd. temp. 99 - 103°C.

D stadija: 5 - hidroksi - 4 - [2 - [(2 - metilfenoksi)metil]fenil] - 3(2H) - izoksazolono gavimas

Į N-metilhidroksilamino chlorhidrato (34,7 g) tirpalą metanolyje (120 ml), atšaldytą ledinio vandens vonioje, buvo pridėta lašais kalio hidroksido (46,6 g) metanolyje (80 ml) tirpalas. Kai pridėjimas buvo baigtas, mišinys buvo maišomas 10 minučių. Kalio chlorido nuosėdos buvo pašalintos filtruojant ir dimetil[2-[(2-metilfenoksi)metil]fenil]propandioato (44 g) tirpalas 100 ml metanolio buvo pridėta į N-metil-hidroksilamino tirpalą. Mišinys buvo maišytas 3 dienas ir po to atšaldytas ledinio vandens vonioje. Buvo pridėta koncentruotos HCl (15 ml) ir kristalai buvo pašalinti filtruojant. Tirpalas buvo atskirtas vakuume ir nuosėdos praskiestos maždaug

100 ml vandens ir po to ekstrahuota dichlormetanu (3x150 ml), po to acetatu (3x100 ml). Sujungti organiniai ekstraktai buvo išdžiovinti (MgSO_4), filtruoti ir kondensuoti sumažintame slėgyje, išeiga 31,3 g (75 %) D stadijos antraštėje nurodyto pusiau kieta junginio.

^1H BMR ($\text{DMSO}-d_6$): δ 7.4 (m,2H), 7.15 (m,2H), 7.10 (m,2H), 6.8 (m,2H), 5.16 (s,2H), 2.9 (s,3H), 2.23 (s,3H).

E stadija: 5-Metoksi-2-metil-4-[2-[(2-metilfenoksi)metil]fenil]-3(2H)-izoksazolono gavimas

5-Hidroksi-4-[2-[(2-metilfenoksi)metil]fenil]-3(2H)-izoksazolonas (31,3 g) buvo ištirpintas 330 ml 10:1 toluenas:metanolis ir atvėsinta ledo vandens vonioje. Trimetilsilil-diazometanas ($\approx 2\text{M}$ heksane) (55 ml) buvo pridėta lašais. Buvo pastebėtas dujų išsiskyrimas. Geltonas tirpalas buvo maišomas 25°C temperatūroje 2 valandas. Tirpalas buvo atskiestas 100 ml vandens ir ekstrahuotas etilacetatu (4x100 ml). Sujungti organiniai ekstraktai buvo išdžiovinti (MgSO_4), filtruoti ir kondensuoti sumažintame slėgyje, gaunant aliejų, kuris buvo grynintas aukšto slėgio adsorbicine staigia chromatografija (silikagelis, 1:1 heksanas:etilacetatas, kaip eliuentas). Kitas išplautas komponentas buvo surinktas, gaunant 4,35 g (13 %) E stadijos antraštėje nurodyto junginio, kaip baltos kietos medžiagos, lyd. temp. $90-92^\circ\text{C}$.

^1H BMR(CDCl_3): δ 7.61 (d,1H) 7.35 (m,3H), 7,12 (m,2H), 6.84 (m,2H), 5,12 (s,2H), 3,96 (s,3H), 3.41 (s,3H), 2,24 (s,3H).

3 PAVYZDYS

A stadija: 1-Metil-N-(2-fenoksimetil)hidrazinkarboksamido gavimas

2-Fenoksianilinas (5,57 g) ir trietilaminas (4,2 ml) buvo ištirpinta 100 ml 1,2-dichloretano. Buvo pridėta trifosgeno ($\text{Cl}_3\text{COC}(=\text{O})\text{OCCl}_3$, 2,97 g) ir susidarė nuosėdos. Mišinys buvo kaitinamas kolboje su grįžtamuoju šaldytuvu ir kieta medžiaga buvo pakartotinai ištirpinta. Po 5,5 val. tirpalas buvo atšaldytas ir buvo pridėta 1,6 ml metil/hidrazino ir susidarė naujos nuosėdos. Mišinys buvo maišomas per naktį kambario temperatūroje. Tirpiklis buvo pašalintas ir likutis buvo padalytas tarp etilacetato ir 1N vandeninio HCl tirpalo. Organinės fazės buvo išdžiovintos (MgSO_4), filtruotos ir koncentruotas sumažintame slėgyje. Nuosėdos buvo išvalytos aukšto slėgio adsorbicine staigia chromatografija (1:1 heksanas:etilacetatas, kaip eliuentas). Antras mažiausias polinis komponentas buvo surinktas, eliuentas buvo pašalintas sumažintame slėgyje ir liekana buvo susmulkinta su heksanu, išeiga 3,86 g (50 %) A stadijos antraštėje nurodyto junginio, lyd. temp. $117-119^\circ\text{C}$.

B stadija: 2-Metil-4-(2-fenoksifenil)-5-tiokso-1,2,4-triazolin-3-ono gavimas

1,54 g 1-Metil-N-(2-fenoksifenil)hidrazinkarboksamido tirpalo 50 ml tetrahidrofurane, atšaldyto ledo vonioje, buvo apdorota 0,46 ml tiofosgeno ir po to 1,68 ml trietilamino. Susidarė nuosėdos ir mišinys buvo maišomas per naktį aplinkos

temperatūroje. Nuosėdos buvo pašalintos filtruojant ir praplauta tetrahidrofuranu. Sujungti filtratas ir praplovimo tirpalai sukonzentruoti sumažintame slėgyje, išeiga 1,8 g gintarinės stikliškos alyvos. Nevalyta medžiaga buvo naudojama kitose stadijose.

^1H BMR(CDCl_3): δ 6.8-7.4 (m, 9H), 3.57 (s, 3H).

C stadija: 2,4-dihidro-2-metil-5-(metiltio)-4-(2-fenoksifenil)-3H-1,2,4-triazol-3-ono gavimas

900 mg nevalyto 2-metil-4-(2-fenoksimetil)-5-tiokso-1,2,4-triazolidin-3-ono tirpalo 50 ml tetrahidrofurane buvo apdorojama 150 mg natrio hidrido (60 % dispersija alyvoje). Po 5 min. buvo pridėta 0,5 ml jodometano ir mišinys buvo maišomas per naktį kambario temperatūroje. Tirpiklis buvo pašalintas filtruojant ir filtratas sukonzentruotas iki alyvos. Alyva paskirstyta tarp eterio ir 1N vandenilio chlorido rūgšties tirpalo. Organinė fazė buvo išdžiovinta (MgSO_4), filtruota ir koncentruota sumažintame slėgyje. Likutis buvo sutrintas heksane/*n*-butilchloride, išeiga 530 mg (56%) C stadijos antraštėje nurodyto junginio, lyd. temp. 129-130°C.

4 PAVYZDYS

A stadija: 2,2-dimetil-N-(2-metilfenil)hidrazino karboksamido gavimas

o-Tolilo izocianatas (10,0 mg) buvo ištirpintas 75 ml tolueno leidžiant N_2 . Tirpalas buvo atvėsintas iki 5° ir į jį atsargiai buvo pridėta 1,1-dimetilhidrazino (5,7 ml) tirpalo toluene. Po pridėjimo ledo vonia buvo pašalinta ir reakcijos suspensija papildomai 10 minučių buvo maišoma. Kieta medžiaga buvo išfiltruota nuosekliai praplaunant heksanu, mažu kiekiu 20 % dietileterio/heksano, po to vėl heksanu. Išeiga 11,1 g (77%) A stadijos antraštėje nurodyto junginio.

^1H BMR(CDCl_3): δ 8.1 (ps, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.21-7.15 (m, 3H), 6.99 (t, 1H), 5.23 (ps, 1H), 2.63 (s, 6H), 2.27 (s, 3H).

B stadija: 5-chloro 2,4-dihidro-2-metil-4-(2-metilfenil)-3H-1,2,4-triazol-3-ono gavimas

Į 11,1 g 2,2-dimetil-N-(2-metilfenil)hidrazino karboksamido tirpalą, ištirpdytą 600 ml metileno chlorido, N_2 atmosferoje, buvo pridėta 17,1 g trifosgeno. Tirpalas buvo kaitintas kolboje su grįžtamuju šaldytuvu per naktį, atvėsintas, po to koncentruotas sumažintame slėgyje. Gautos nuosėdos buvo ištirpintos etilacetate ir praplautos vandeniu, po to sočiu vandeniniu NaCl. Organinė fazė buvo išdžiovinta (MgSO_4), filtruota ir koncentruota sumažintame slėgyje. Nuosėdos buvo išvalytos aukšto slėgio adsorbicine staigia chromatografija (30-50% etilacetatas/heksanas, kaip eliuentas), išeiga 8,25 g (64 %) B stadijos antraštėje nurodyto junginio.

^1H BMR(CDCl_3): δ 7.42 - 7.30 (m, 3H), 7.17 (d, 1H), 3.54 (s, 3H), 2.22 (s, 3H).

C stadija: 2,4-dihidro-5-metoksi-2-metil-4-(2-metilfenil)-3H-1,2,4-triazol-3-ono gavimas

8,25 g 5-chloro-2,4-dihidro-2-metil-4-(2-metilfenil)-3H-1,2,4-triazol-3-ono buvo ištirpinta 80 ml 1:1 dimetoksietano/metanolio, N₂ atmosferoje. Buvo pridėta 14,0 ml natrio metoksido (30 % tirpalo metanolyje) ir tirpalas buvo kaitinamas kolboje su grįžtamuoju šaldytuvu 3 val.. Mišiniui buvo leista atvėsti, atskiesta etilacetatu, praplauta vandeniu, po to prisotinta vandeniniu NaCl. Sujungti organiniai ekstraktai buvo išdžiovinti (MgSO₄), filtruoti ir koncentruoti sumažintame slėgyje. Nuosėdos buvo išvalytos aukšto slėgio adsorbicine staigia chromatografija (50-70 % etilacetatas/heksanas kaip eliuentas) ir sutrinta su 50 % dietileterio/heksano, išeiga 6,7 g C stadijos antraštėje nurodyto junginio (95 % grynumas).

¹H BMR(CDCl₃): δ 7.35-7.27 (m,3H), 7.18 (d,1H), 3.94 (s,3H), 3.46 (s,3H), 2.22 (s,3H).

D stadija: 4-[2-(Brommetil)fenil]-2,4-dihidro-5-metoksi-2-metil-3H-1,2,4-triazol-3-ono gavimas

6,7 g 2,4-dihidro-5-metoksi-2-metil-4-(2metilfenil)-3H-1,2,4-triazol-3-ono tirpalo/suspensijos ištirpinta 95 ml tetrachlormetano N₂ atmosferoje, buvo pridėta N-bromsukcinimido (6,53 g), toliau katalitinis kiekis benzoilo peroksido. Tirpalas buvo 2 val. kaitinamas kolboje su grįžtamuoju šaldytuvu. Buvo pridėta kitas 1,63 g N-bromsukcinimido ir katalitinis kiekis benzoilo peroksido ir tirpalas buvo valandą kaitinamas kolboje su grįžtamuoju šaldytuvu. Atvėsinus buvo pridėta dichlormetano ir organinis sluoksnis buvo nuosekliai išplautas vandeniu, po to 0,1 N dinatrio tiosulfato tirpalu, po to NaCl sočiu vandeniniu tirpalu. Sujungti organiniai ekstraktai buvo išdžiovinti (MgSO₄), filtruoti ir koncentruoti sumažintame slėgyje. Nuosėdos buvo išvalytos aukšto slėgio adsorbicine staigia chromatografija (3-10 % dietileteris/dichlormetanas kaip eliuentas), išeiga 3,12 g D stadijos antraštėje nurodyto junginio.

¹H BMR(CDCl₃): δ 7.5 (m,1H), 7.44 (m,2H), 7.22 (m,1H), 4.60 (d,1H), 4.36 (d,1H), 3.96 (s,3H), 3.47 (s,3H).

E stadija: 2,4-dihidro-5-metoksi-2-metil-4-[2-[[[(fenilmetileno)amino]-oksi]metil]fenil]-3H-1,2,4-triazol-3-ono gavimas

0,40 g 4-[2-(bromometil)fenil]-2,4-dihidro-5-metoksi-2-metil-3H-1,2,4-triazol-3-ono buvo ištirpinta maždaug 5 ml N,N-dimetilformamido N₂ atmosferoje ir į tai buvo pridėta 0,20 g acetofenono oksimo, toliau 0,07g 60 % natrio hidrido. Tirpalas buvo 4 val. maišomas kambario temperatūroje, po to praskiestas etilacetatu, praplautas vandeniu, tada sočiu vandeniniu NaCl tirpalu. Organinė fazė buvo išdžiovinta (MgSO₄), filtruota ir koncentruota sumažintame slėgyje. Nuosėdos buvo išgrynintos aukšto slėgio adsorbicine staigia chromatografija (60 % etilacetatas/heksanas kaip eliuentas), išeiga 0,38 g E stadijos antraštėje nurodyto junginio.

^1H BMR(CDCl_3): δ 7.6 (m, 3H), 7.44 (m, 2H), 7.35 (m, 3H), 7.25 (m, 1H), 5.26 (d, 1H), 5.22 (d, 1H), 3.88 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 2.20 (s, 3H).

Junginiai, pateikti 1-26 lentelėse gali būti gauti čia aprašytais pagrindiniais būdais arba jų modifikacijomis.

Toliau pateiktose lentelėse naudojami sutrumpinimai. Visos alkilo grupės, jei kitaip nenurodyta, yra normalūs izomerai.

n = normalus

i = izo

Me = metilas

Et = etilas

MeO = metoksi

Pr = propilas

CN = ciano

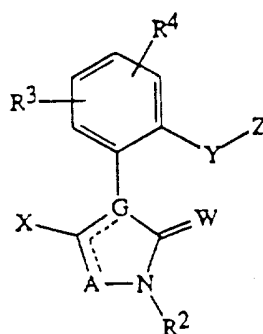
c = ciklo

MeS = metiltio

Bu = butilas

Ph = fenilas

NO_2 = nitro



1 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: $G = C$, $W = O$, $R^3 = R^4 = H$, $Y = \text{CH}_2\text{ON} = \text{C}(\text{CH}_3)$, $Z = 3\text{-CF}_3\text{-Ph}$, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir

$R^2 = \text{Me}$

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	O	MeS	O
EtO	O	EtS	O
n-PrO	O	n-PrS	O
$\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$	O	$\text{H}_2\text{C}=\text{HCH}_2\text{S}$	O
$\text{HC}=\text{CCH}_2\text{O}$	O	$\text{HC}=\text{CCH}_2\text{S}$	O
CF_3O	O	CF_3S	O
(c-propilas)O	O	(c-propilas)S	O

LT 4112 B

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	S	MeS	S
EtO	S	EtS	S
n-PrO	S	n-PrS	S
H ₂ C=CHCH ₂ O	S	H ₂ C=CHCH ₂ S	S
HC=CCH ₂ O	S	HC=CCH ₂ S	S
CF ₃ O	S	CF ₃ S	S
(c-propilas)O	S	(c-propilas)S	S
<u>R² = Et</u>			
<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	O	MeS	O
EtO	O	EtS	O
n-PrO	O	n-PrS	O
H ₂ C=CHCH ₂ O	O	H ₂ C=HCH ₂ S	O
HC=CCH ₂ O	O	HC=CCH ₂ S	O
CF ₃ O	O	CF ₃ S	O
(c-propilas)O	O	(c-propilas)S	O
<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	S	MeS	S
EtO	S	EtS	S
n-PrO	S	n-PrS	S
H ₂ C=CHCH ₂ O	S	H ₂ C=CHCH ₂ S	S
HC=CCH ₂ O	S	HC=CCH ₂ S	S
CF ₃ O	S	CF ₃ S	S
(c-propilas)O	S	(c-propilas)S	S
<u>R² = n-Pr</u>			
<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	O	MeS	O
EtO	O	EtS	O
n-PrO	O	n-PrS	O
H ₂ C=CHCH ₂ O	O	H ₂ C=HCH ₂ S	O
HC=CCH ₂ O	O	HC=CCH ₂ S	O
CF ₃ O	O	CF ₃ S	O
(c-propilas)O	O	(c-propilas)S	O

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	S	MeS	S
EtO	S	EtS	S
n-PrO	S	n-PrS	S
H ₂ C=CHCH ₂ O	S	H ₂ C=CHCH ₂ S	S
HC=CCH ₂ O	S	HC=CCH ₂ S	S
CF ₃ O	S	CF ₃ S	S
(c-propilas)O	S	(c-propilas)S	S

R² = H

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	O	MeS	O
EtO	O	EtS	O
n-PrO	O	n-PrS	O
H ₂ C=CHCH ₂ O	O	H ₂ C=HCH ₂ S	O
HC=CCH ₂ O	O	HC=CCH ₂ S	O
CF ₃ O	O	CF ₃ S	O
(c-propilas)O	O	(c-propilas)S	O

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	S	MeS	S
EtO	S	EtS	S
n-PrO	S	n-PrS	S
H ₂ C=CHCH ₂ O	S	H ₂ C=CHCH ₂ S	S
HC=CCH ₂ O	S	HC=CCH ₂ S	S
CF ₃ O	S	CF ₃ S	S
(c-propilas)O	S	(c-propilas)S	S

R² = Me

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	NH	MeS	NH
EtO	NH	EtS	NH
n-PrO	NH	n-PrS	NH
H ₂ C=CHCH ₂ O	NH	H ₂ C=HCH ₂ S	NH
HC=CCH ₂ O	NH	HC=CCH ₂ S	NH
CF ₃ O	NH	CF ₃ S	NH
(c-propilas)O	NH	(c-propilas)S	NH

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	NMe	MeS	NMe
EtO	NMe	EtS	NMe
n-PrO	NMe	n-PrS	NMe
H ₂ C=CHCH ₂ O	NMe	H ₂ C=CHCH ₂ S	NMe
HC=CCH ₂ O	NMe	HC=CCH ₂ S	NMe
CF ₃ O	NMe	CF ₃ S	NMe
(c-propilas)O	NMe	(c-propilas)S	NMe
 <u>R² = H</u>			
<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	NH	MeS	NH
EtO	NH	EtS	NH
n-PrO	NH	n-PrS	NH
H ₂ C=CHCH ₂ O	NH	H ₂ C=HCH ₂ S	NH
HC=CCH ₂ O	NH	HC=CCH ₂ S	NH
CF ₃ O	NH	CF ₃ S	NH
(c-propilas)O	NH	(c-propilas)S	NH
<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	NMe	MeS	NMe
EtO	NMe	EtS	NMe
n-PrO	NMe	n-PrS	NMe
H ₂ C=CHCH ₂ O	NMe	H ₂ C=CHCH ₂ S	NMe
HC=CCH ₂ O	NMe	HC=CCH ₂ S	NMe
CF ₃ O	NMe	CF ₃ S	NMe
(c-propilas)O	NMe	(c-propilas)S	NMe

2 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: G = C, W = O, R³ = R⁴ = H, Y=CH₂ON=C(CH₃), Z = 3-CF₃-Ph, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie A, ir R² = Me

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	N	MeS	N
EtO	N	EtS	N
n-PrO	N	n-PrS	N
H ₂ C=CHCH ₂ O	N	H ₂ C=HCH ₂ S	N
HC=CCH ₂ O	N	HC=CCH ₂ S	N
CF ₃ O	N	CF ₃ S	N
(c-propilas)O	N	(c-propilas)S	N
<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CH	MeS	CH
EtO	CH	EtS	CH
n-PrO	CH	n-PrS	CH
H ₂ C=CHCH ₂ O	CH	H ₂ C=CHCH ₂ S	CH
HC=CCH ₂ O	CH	HC=CCH ₂ S	CH
CF ₃ O	CH	CF ₃ S	CH
(c-propilas)O	CH	(c-propilas)S	CH
<u>R² = Et</u>			
<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	N	MeS	N
EtO	N	EtS	N
n-PrO	N	n-PrS	N
H ₂ C=CHCH ₂ O	N	H ₂ C=HCH ₂ S	N
HC=CCH ₂ O	N	HC=CCH ₂ S	N
CF ₃ O	N	CF ₃ S	N
(c-propilas)O	N	(c-propilas)S	N
<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CH	MeS	CH
EtO	CH	EtS	CH
n-PrO	CH	n-PrS	CH
H ₂ C=CHCH ₂ O	CH	H ₂ C=CHCH ₂ S	CH
HC=CCH ₂ O	CH	HC=CCH ₂ S	CH
CF ₃ O	CH	CF ₃ S	CH
(c-propilas)O	CH	(c-propilas)S	CH

$R^2 = n\text{-Pr}$

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	N	MeS	N
EtO	N	EtS	N
n-PrO	N	n-PrS	N
H ₂ C=CHCH ₂ O	N	H ₂ C=HCH ₂ S	N
HC=CCH ₂ O	N	HC=CCH ₂ S	N
CF ₃ O	N	CF ₃ S	N
(c-propilas)O	N	(c-propilas)S	N

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CH	MeS	CH
EtO	CH	EtS	CH
n-PrO	CH	n-PrS	CH
H ₂ C=CHCH ₂ O	CH	H ₂ C=CHCH ₂ S	CH
HC=CCH ₂ O	CH	HC=CCH ₂ S	CH
CF ₃ O	CH	CF ₃ S	CH
(c-propilas)O	CH	(c-propilas)S	CH

 $R^2 = H$

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	N	MeS	N
EtO	N	EtS	N
n-PrO	N	n-PrS	N
H ₂ C=CHCH ₂ O	N	H ₂ C=HCH ₂ S	N
HC=CCH ₂ O	N	HC=CCH ₂ S	N
CF ₃ O	N	CF ₃ S	N
(c-propilas)O	N	(c-propilas)S	N

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CH	MeS	CH
EtO	CH	EtS	CH
n-PrO	CH	n-PrS	CH
H ₂ C=CHCH ₂ O	CH	H ₂ C=CHCH ₂ S	CH
HC=CCH ₂ O	CH	HC=CCH ₂ S	CH
CF ₃ O	CH	CF ₃ S	CH
(c-propilas)O	CH	(c-propilas)S	CH

R² = Me

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CMe	MeS	CMe
EtO	CMe	EtS	CMe
n-PrO	CMe	n-PrS	CMe
H ₂ C=CHCH ₂ O	CMe	H ₂ C=HCH ₂ S	CMe
HC=CCH ₂ O	CMe	HC=CCH ₂ S	CMe
CF ₃ O	CMe	CF ₃ S	CMe
(c-propilas)O	CMe	(c-propilas)S	CMe

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CEt	MeS	CEt
EtO	CEt	EtS	CEt
n-PrO	CEt	n-PrS	CEt
H ₂ C=CHCH ₂ O	CEt	H ₂ C=CHCH ₂ S	CEt
HC=CCH ₂ O	CEt	HC=CCH ₂ S	CEt
CF ₃ O	CEt	CF ₃ S	CEt
(c-propilas)O	CEt	(c-propilas)S	CEt

R² = H

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CEt	MeS	CEt
EtO	CEt	EtS	CEt
n-PrO	CEt	n-PrS	CEt
H ₂ C=CHCH ₂ O	CEt	H ₂ C=HCH ₂ S	CEt
HC=CCH ₂ O	CEt	HC=CCH ₂ S	CEt
CF ₃ O	CEt	CF ₃ S	CEt
(c-propilas)O	CEt	(c-propilas)S	CEt

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CMe	MeS	CMe
EtO	CMe	EtS	CMe
n-PrO	CMe	n-PrS	CMe
H ₂ C=CHCH ₂ O	CMe	H ₂ C=CHCH ₂ S	CMe
HC=CCH ₂ O	CMe	HC=CCH ₂ S	CMe
CF ₃ O	CMe	CF ₃ S	CMe
(c-propilas)O	CMe	(c-propilas)S	CMe

3 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: $G = C$, $W = O$, $R^3 = R^4 = H$, $Y = CH_2O$,

$Z = 2\text{-Me-Ph}$, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir

$R^2 = Me$

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	O	MeS	O
EtO	O	EtS	O
n-PrO	O	n-PrS	O
$H_2C=CHCH_2O$	O	$H_2C=HCH_2S$	O
$HC=CCH_2O$	O	$HC=CCH_2S$	O
CF_3O	O	CF_3S	O
(c-propilas)O	O	(c-propilas)S	O

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	S	MeS	S
EtO	S	EtS	S
n-PrO	S	n-PrS	S
$H_2C=CHCH_2O$	S	$H_2C=CHCH_2S$	S
$HC=CCH_2O$	S	$HC=CCH_2S$	S
CF_3O	S	CF_3S	S
(c-propilas)O	S	(c-propilas)S	S

$R^2 = Et$

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	O	MeS	O
EtO	O	EtS	O
n-PrO	O	n-PrS	O
$H_2C=CHCH_2O$	O	$H_2C=HCH_2S$	O
$HC=CCH_2O$	O	$HC=CCH_2S$	O
CF_3O	O	CF_3S	O
(c-propilas)O	O	(c-propilas)S	O

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	S	MeS	S
EtO	S	EtS	S
n-PrO	S	n-PrS	S
H ₂ C=CHCH ₂ O	S	H ₂ C=CHCH ₂ S	S
HC=CCH ₂ O	S	HC=CCH ₂ S	S
CF ₃ O	S	CF ₃ S	S
(c-propilas)O	S	(c-propilas)S	S

R² = n-Pr

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	O	MeS	O
EtO	O	EtS	O
n-PrO	O	n-PrS	O
H ₂ C=CHCH ₂ O	O	H ₂ C=HCH ₂ S	O
HC=CCH ₂ O	O	HC=CCH ₂ S	O
CF ₃ O	O	CF ₃ S	O
(c-propilas)O	O	(c-propilas)S	O

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	S	MeS	S
EtO	S	EtS	S
n-PrO	S	n-PrS	S
H ₂ C=CHCH ₂ O	S	H ₂ C=CHCH ₂ S	S
HC=CCH ₂ O	S	HC=CCH ₂ S	S
CF ₃ O	S	CF ₃ S	S
(c-propilas)O	S	(c-propilas)S	S

R² = H

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	O	MeS	O
EtO	O	EtS	O
n-PrO	O	n-PrS	O
H ₂ C=CHCH ₂ O	O	H ₂ C=HCH ₂ S	O
HC=CCH ₂ O	O	HC=CCH ₂ S	O
CF ₃ O	O	CF ₃ S	O
(c-propilas)O	O	(c-propilas)S	O

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	S	MeS	S
EtO	S	EtS	S
n-PrO	S	n-PrS	S
H ₂ C=CHCH ₂ O	S	H ₂ C=CHCH ₂ S	S
HC=CCH ₂ O	S	HC=CCH ₂ S	S
CF ₃ O	S	CF ₃ S	S
(c-propilas)O	S	(c-propilas)S	S

R² = Me

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	NH	MeS	NH
EtO	NH	EtS	NH
n-PrO	NH	n-PrS	NH
H ₂ C=CHCH ₂ O	NH	H ₂ C=HCH ₂ S	NH
HC=CCH ₂ O	NH	HC=CCH ₂ S	NH
CF ₃ O	NH	CF ₃ S	NH
(c-propilas)O	NH	(c-propilas)S	NH

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	NMe	MeS	NMe
EtO	NMe	EtS	NMe
n-PrO	NMe	n-PrS	NMe
H ₂ C=CHCH ₂ O	NMe	H ₂ C=CHCH ₂ S	NMe
HC=CCH ₂ O	NMe	HC=CCH ₂ S	NMe
CF ₃ O	NMe	CF ₃ S	NMe
(c-propilas)O	NMe	(c-propilas)S	NMe

R² = H

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	NH	MeS	NH
EtO	NH	EtS	NH
n-PrO	NH	n-PrS	NH
H ₂ C=CHCH ₂ O	NH	H ₂ C=HCH ₂ S	NH
HC=CCH ₂ O	NH	HC=CCH ₂ S	NH
CF ₃ O	NH	CF ₃ S	NH
(c-propilas)O	NH	(c-propilas)S	NH

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	NMe	MeS	NMe
EtO	NMe	EtS	NMe
n-PrO	NMe	n-PrS	NMe
H ₂ C=CHCH ₂ O	NMe	H ₂ C=CHCH ₂ S	NMe
HC=CCH ₂ O	NMe	HC=CCH ₂ S	NMe
CF ₃ O	NMe	CF ₃ S	NMe
(c-propilas)O	NMe	(c-propilas)S	NMe

4 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: G = N, W = O, R³ = R⁴ = H, Y=CH₂O,
Z = 2-Me-Ph, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie A, ir

R² = Me

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	N	MeS	N
EtO	N	EtS	N
n-PrO	N	n-PrS	N
H ₂ C=CHCH ₂ O	N	H ₂ C=HCH ₂ S	N
HC=CCH ₂ O	N	HC=CCH ₂ S	N
CF ₃ O	N	CF ₃ S	N
(c-propilas)O	N	(c-propilas)S	N

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CH	MeS	CH
EtO	CH	EtS	CH
n-PrO	CH	n-PrS	CH
H ₂ C=CHCH ₂ O	CH	H ₂ C=CHCH ₂ S	CH
HC=CCH ₂ O	CH	HC=CCH ₂ S	CH
CF ₃ O	CH	CF ₃ S	CH
(c-propilas)O	CH	(c-propilas)S	CH

R² = Et

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	N	MeS	N
EtO	N	EtS	N
n-PrO	N	n-PrS	N
H ₂ C=CHCH ₂ O	N	H ₂ C=HCH ₂ S	N
HC=CCH ₂ O	N	HC=CCH ₂ S	N
CF ₃ O	N	CF ₃ S	N
(c-propilas)O	N	(c-propilas)S	N

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CH	MeS	CH
EtO	CH	EtS	CH
n-PrO	CH	n-PrS	CH
H ₂ C=CHCH ₂ O	CH	H ₂ C=CHCH ₂ S	CH
HC=CCH ₂ O	CH	HC=CCH ₂ S	CH
CF ₃ O	CH	CF ₃ S	CH
(c-propilas)O	CH	(c-propilas)S	CH

R² = n-Pr

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	N	MeS	N
EtO	N	EtS	N
n-PrO	N	n-PrS	N
H ₂ C=CHCH ₂ O	N	H ₂ C=HCH ₂ S	N
HC=CCH ₂ O	N	HC=CCH ₂ S	N
CF ₃ O	N	CF ₃ S	N
(c-propilas)O	N	(c-propilas)S	N

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CH	MeS	CH
EtO	CH	EtS	CH
n-PrO	CH	n-PrS	CH
H ₂ C=CHCH ₂ O	CH	H ₂ C=CHCH ₂ S	CH
HC=CCH ₂ O	CH	HC=CCH ₂ S	CH
CF ₃ O	CH	CF ₃ S	CH
(c-propilas)O	CH	(c-propilas)S	CH

R² = H

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	N	MeS	N
EtO	N	EtS	N
n-PrO	N	n-PrS	N
H ₂ C=CHCH ₂ O	N	H ₂ C=HCH ₂ S	N
HC=CCH ₂ O	N	HC=CCH ₂ S	N
CF ₃ O	N	CF ₃ S	N
(c-propilas)O	N	(c-propilas)S	N

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CH	MeS	CH
EtO	CH	EtS	CH
n-PrO	CH	n-PrS	CH
H ₂ C=CHCH ₂ O	CH	H ₂ C=CHCH ₂ S	CH
HC=CCH ₂ O	CH	HC=CCH ₂ S	CH
CF ₃ O	CH	CF ₃ S	CH
(c-propilas)O	CH	(c-propilas)S	CH

R² = Me

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CMe	MeS	CMe
EtO	CMe	EtS	CMe
n-PrO	CMe	n-PrS	CMe
H ₂ C=CHCH ₂ O	CMe	H ₂ C=HCH ₂ S	CMe
HC=CCH ₂ O	CMe	HC=CCH ₂ S	CMe
CF ₃ O	CMe	CF ₃ S	CMe
(c-propilas)O	CMe	(c-propilas)S	CMe

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CEt	MeS	CEt
EtO	CEt	EtS	CEt
n-PrO	CEt	n-PrS	CEt
H ₂ C=CHCH ₂ O	CEt	H ₂ C=CHCH ₂ S	CEt
HC=CCH ₂ O	CEt	HC=CCH ₂ S	CEt
CF ₃ O	CEt	CF ₃ S	CEt
(c-propilas)O	CEt	(c-propilas)S	CEt

$R^2 = H$

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CEt	MeS	CEt
EtO	CEt	EtS	CEt
n-PrO	CEt	n-PrS	CEt
H ₂ C=CHCH ₂ O	CEt	H ₂ C=HCH ₂ S	CEt
HC=CCH ₂ O	CEt	HC=CCH ₂ S	CEt
CF ₃ O	CEt	CF ₃ S	CEt
(c-propilas)O	CEt	(c-propilas)S	Cet

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	CMe	MeS	CMe
EtO	CMe	EtS	CMe
n-PrO	CMe	n-PrS	CMe
H ₂ C=CHCH ₂ O	CMe	H ₂ C=CHCH ₂ S	CMe
HC=CCH ₂ O	CMe	HC=CCH ₂ S	CMe
CF ₃ O	CMe	CF ₃ S	CMe
(c-propilas)O	CMe	(c-propilas)S	CMe

5 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: G = C, W = S, R³ = R⁴ = H, Y=CH₂ON=C(CH₃), Z = 3-CF₃-Ph, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir $R^2 = Me$

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	O	MeS	O
EtO	O	EtS	O
n-PrO	O	n-PrS	O
H ₂ C=CHCH ₂ O	O	H ₂ C=HCH ₂ S	O
HC=CCH ₂ O	O	HC=CCH ₂ S	O
CF ₃ O	O	CF ₃ S	O
MeO	NH	MeO	NMe

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	S	MeS	S
EtO	S	EtS	S
n-PrO	S	n-PrS	S
H ₂ C=CHCH ₂ O	S	H ₂ C=CHCH ₂ S	S
HC=CCH ₂ O	S	HC=CCH ₂ S	S
CF ₃ O	S	CF ₃ S	S
MeO	NEt	MeS	NPr

6 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: A = N, G = N, W = S, R³ = R⁴ = H, Y=CH₂ON=C(Me), Z = 3-CF₃-Ph, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie A, ir R² = Me

<u>X</u>	<u>X</u>	<u>X</u>	<u>X</u>
MeO	EtO	n-PrO	H ₂ C=CHCH ₂ S
HC=CCH ₂ O	CF ₃ O	OCF ₂ H	OCH ₂ CF ₃
(c-propilas)O	MeS	EtS	n-PrS
H ₂ C=CHCH ₂ O	HC=CCH ₂ S	CF ₃ S	(c-propilas)S

7 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: G = C, W = S, R³ = R⁴ = H, Y=CH₂O, Z = 2-Me-Ph, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir R² = Me

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	O	MeS	O
EtO	O	EtS	O
n-PrO	O	n-PrS	O
H ₂ C=CHCH ₂ O	O	H ₂ C=HCH ₂ S	O
HC=CCH ₂ O	O	HC=CCH ₂ S	O
CF ₃ O	O	CF ₃ S	O
MeO	NH	MeO	NMe

<u>X</u>	<u>A</u>	<u>X</u>	<u>A</u>
MeO	S	MeS	S
EtO	S	EtS	S
n-PrO	S	n-PrS	S
H ₂ C=CHCH ₂ O	S	H ₂ C=CHCH ₂ S	S
HC=CCH ₂ O	S	HC=CCH ₂ S	S
CF ₃ O	S	CF ₃ S	S
MeO	NEt	MeS	NPr

8 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: A = N, G = N, W = S, R³ = R⁴ = H, Y=CH₂O, Z = 2-Me-Ph, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie A, ir

R² = Me

<u>X</u>	<u>X</u>	<u>X</u>	<u>X</u>
MeO	EtO	n-PrO	H ₂ C=CHCH ₂ S
HC=CCH ₂ O	CF ₃ O	OCF ₂ H	OCH ₂ CF ₃
(c-propilas)O	MeS	EtS	n-PrS
H ₂ C=CHCH ₂ O	HC=CCH ₂ S	CF ₃ S	(c-propilas)S

9 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: G = C, A = W = O, X = MeO, R² = Me, Y=CH₂ON = C(Me), Z = 3-CF₃-Ph, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir

<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴Z</u>	<u>R³Z</u>	<u>R⁴Z</u>
3-F	H	5-NO ₂	H	3-F	5-F
5-F	H	6-Me	H	3-Cl	5-Cl
3-Cl	H	3-Me	H	4-Me	5-Cl
4-Cl	H	4-MeO	H	3-F	5-CF ₃
5-Br	H	5-CF ₃ O	H	3-Cl	5-NO ₂
4-CF ₃	H	5-alilas	H	6-CF ₃ O	H
5-CN	H	4-propargilas	H	5-Pr	H

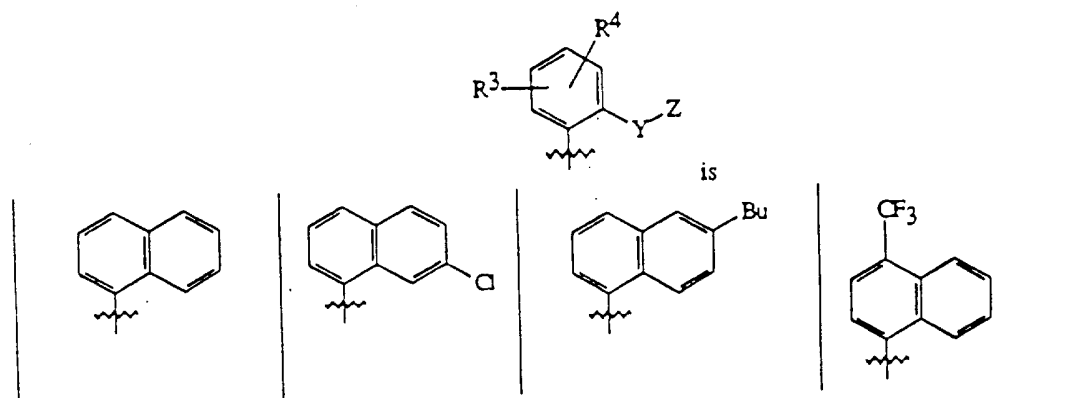
10 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: A = N, G = N, W = O, X = MeO, R² = Me, Y=CH₂ON = C(Me), Z = 3-CF₃-Ph, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie A, ir

$\underline{R^3}$	$\underline{R^4}$	$\underline{R^3}$	$\underline{R^4}$	$\underline{R^3}$	$\underline{R^4}$
3-F	H	5-NO ₂	H	3-F	5-F
5-F	H	6-Me	H	3-Cl	5-Cl
3-Cl	H	3-Me	H	4-Me	5-Cl
4-Cl	H	4-MeO	H	3-F	5-CF ₃
5-Br	H	5-CF ₃ O	H	3-Cl	5-NO ₂
4-CF ₃	H	5-alilas	H	6-CF ₃ O	H
5-CN	H	4-propargilas	H	5-Pr	H

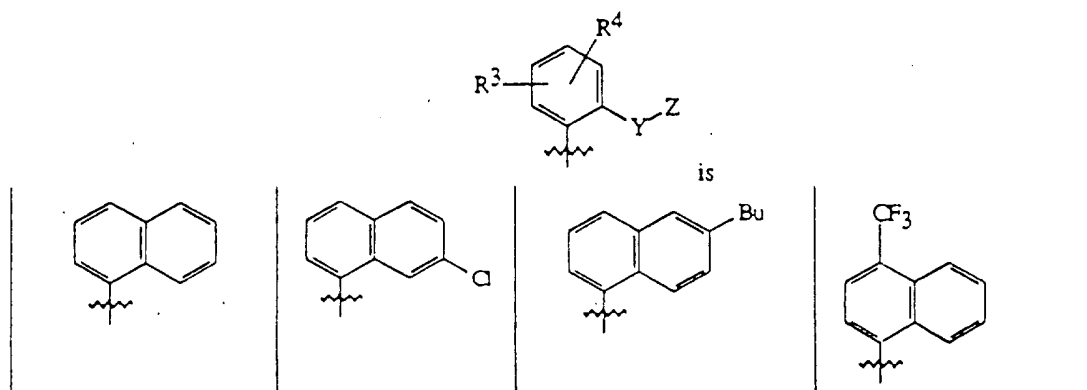
11 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: A = O, G = C, W = O, X = MeO, R² = Me, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir



12 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: A = N, G = N, W = O, X = MeO, R² = Me, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir



13 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: $G = C$, $W = O$, $X = MeO$, $R^2 = Me$, $R^3 = R^4 = H$, $Z = Ph$, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G , ir

A = O

<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>
S	CH_2CH_2	$CH(Me)O$	SCH_2	$C(Me)=N-O$
$CH=CH$	$CH(Me)CH_2$	OCH_2	$SCH(Me)$	$O-N=CH$
$C(Me)=CH$	$CH_2CH(Me)$	$OCH(Me)$	$CH_2O-N=CH$	$O-N=C(Me)$
$CH=C(Me)$	$CH(Me)CH(Me)$	CH_2S	$CH_2O-N=C(Me)$	$CH_2OC(=O)$
$C(Me)=C(Me)$	CH_2O	$CH(Me)S$	$CH=N-O$	$CH(Me)OC(=O)$
tiesioginė jungtis	$C=C$			

A = S

<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>
S	CH_2CH_2	$CH(Me)O$	SCH_2	$C(Me)=N-O$
$CH=CH$	$CH(Me)CH_2$	OCH_2	$SCH(Me)$	$O-N=CH$
$C(Me)=CH$	$CH_2CH(Me)$	$OCH(Me)$	$CH_2O-N=CH$	$O-N=C(Me)$
$CH=C(Me)$	$CH(Me)CH(Me)$	CH_2S	$CH_2O-N=C(Me)$	$CH_2OC(=O)$
$C(Me)=C(Me)$	CH_2O	$CH(Me)S$	$CH=N-O$	$CH(Me)OC(=O)$
tiesioginė jungtis	$C=C$			

A = NMe

<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>
S	CH_2CH_2	$CH(Me)O$	SCH_2	$C(Me)=N-O$
$CH=CH$	$CH(Me)CH_2$	OCH_2	$SCH(Me)$	$O-N=CH$
$C(Me)=CH$	$CH_2CH(Me)$	$OCH(Me)$	$CH_2O-N=CH$	$O-N=C(Me)$
$CH=C(Me)$	$CH(Me)CH(Me)$	CH_2S	$CH_2O-N=C(Me)$	$CH_2OC(=O)$
$C(Me)=C(Me)$	CH_2O	$CH(Me)S$	$CH=N-O$	$CH(Me)OC(=O)$
tiesioginė jungtis	$C=C$			

14 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: $G = N$, $W = O$, $X = MeO$, $R^2 = Me$, $R^3 = R^4 = H$, $Z = Ph$, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G , ir

A = N

<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>
S	CH ₂ CH ₂	CH(Me)O	SCH ₂	C(Me)=N-O
CH=CH	CH(Me)CH ₂	OCH ₂	SCH(Me)	O-N=CH
C(Me)=CH	CH ₂ CH(Me)	OCH(Me)	CH ₂ O-N=CH	O-N=C(Me)
CH=C(Me)	CH(Me)CH(Me)	CH ₂ S	CH ₂ O-N=C(Me)	CH ₂ OC(=O)
C(Me)=C(Me)	CH ₂ O	CH(Me)S	CH=N-O	CH(Me)OC(=O)
tiesioginė jungtis	C=C			

A = S

<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>
S	CH ₂ CH ₂	CH(Me)O	SCH ₂	C(Me)=N-O
CH=CH	CH(Me)CH ₂	OCH ₂	SCH(Me)	O-N=CH
C(Me)=CH	CH ₂ CH(Me)	OCH(Me)	CH ₂ O-N=CH	O-N=C(Me)
CH=C(Me)	CH(Me)CH(Me)	CH ₂ S	CH ₂ O-N=C(Me)	CH ₂ OC(=O)
C(Me)=C(Me)	CH ₂ O	CH(Me)S	CH=N-O	CH(Me)OC(=O)
tiesioginė jungtis	C=C			

A = NMe

<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>	<u>Y</u>
S	CH ₂ CH ₂	CH(Me)O	SCH ₂	C(Me)=N-O
CH=CH	CH(Me)CH ₂	OCH ₂	SCH(Me)	O-N=CH
C(Me)=CH	CH ₂ CH(Me)	OCH(Me)	CH ₂ O-N=CH	O-N=C(Me)
CH=C(Me)	CH(Me)CH(Me)	CH ₂ S	CH ₂ O-N=C(Me)	CH ₂ OC(=O)
C(Me)=C(Me)	CH ₂ O	CH(Me)S	CH=N-O	CH(Me)OC(=O)
tiesioginė jungtis	C=C			

15 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: G = C, W = O, X = MeO, R² = Me, R³ = R⁴ = H, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir

Y = O, A = O

<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>
heksilas	4-oktenilas	3-pentinilas	4-PhO-2-piridinilas
PhO(CH ₂) ₃	PhCH=CHCH ₂	PhC≡CCH ₂	(c-propilas)CH ₂
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-pirimidinilas
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-pirimidinilas
2,4-diCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-triCl-Ph	4-EtO-2-pirimidinilas
2-CF ₃ -Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(4-pirimidiniloksi)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)-Ph	3-(2-Et-Ph)-Ph	4-(2-tienilas)Ph
c-heksilas	3,5-diCl-Ph	6-Ph-2-piridinilas	3-(2-piridiniloksi)Ph
4-NO ₂ -Ph	3,5-diCF ₃ -Ph	6-PhO-4-piridinilas	3-piridinilas
PhCH ₂ CH ₂	2-MeO-Ph	3-tieniloksi-Ph	4-(3-Cl-2-piridiniloksi)-Ph
(2-CN-Ph)CH ₂	2,6-diMeO-Ph	3-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	4-(PhO)-c-heksilas
CF ₃ CH ₂	3-(2CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-pirimidinilas
2-MeS-Ph	5-PhO-3 piridinilas	5-PhO-2-piridinilas	6-(2-NO ₂ -PhO)-4-pirimidinilas
i-Bu	6-Me-2-piridinilas	6-PhO-2-piridinilas	6-(2-Cl-PhO)-4-pirimidinilas
2-CF ₃ O-Ph	3-CFO-Ph	6-CF-2-piridinilas	6-(2-CF ₃ -PhO)-4-pirimidinilas
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-piridinilas	4,6-diMeO-2-pirimidinilas
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-pirimidinilas	4,6-diMe-2-pirimidinilas
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-pirimidinilas	6-CF ₃ -4-pirimidinilas
3-CF ₃ -Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-piridinilas
3-Cl-2-MePh	4-t-Bu-Ph	4-Me-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-pirimidinilas
3-t-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-pirimidinilas	2-piridinilas
3-NO ₂ -Ph	4-NO ₂ -Ph	2-Ph-4-tiazolilas	6-CF ₃ -2-pirazinilas
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-piridazinilas	5-CF ₃ -3-piridinilas
4-CF-Ph	3-Ph-Ph	5-Me-2-furanilas	3-MeO-2-piridinilas
3,4-diCl-Ph	3,4-diMe-Ph	2,5-diMe-3-tienilas	5-CN-2-piridinilas
3,4-diCF-Ph	3,5-diMe-Ph	3-OCF ₂ H-Ph	6-Me-2-piridinilas
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF ₂ H-PH	

Y = CH₂O, A = O

<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>
heksilas	4-oktenilas	3-pentinilas	4-PhO-2-piridinilas
PhO(CH ₂) ₃	PhCH=CHCH ₂	PhC≡CCH ₂	(c-propilas)CH ₂
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-pirimidinilas
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-pirimidinilas
2,4-diCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-triCl-Ph	4-EtO-2-pirimidinilas
2-CF ₃ -Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(4-pirimidiniloksi)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)-Ph	3-(2-Et-Ph)-Ph	4-(2-tienilas)Ph
c-heksilas	3,5-diCl-Ph	6-Ph-2-piridinilas	3-(2-piridiniloksi)Ph
4-NO ₂ -Ph	3,5-diCF ₃ -Ph	6-PhO-4-piridinilas	3-piridinilas
PhCH ₂ CH ₂	2-MeO-Ph	3-tieniloksi-Ph	4-(3-Cl-2-piridiniloksi)-Ph
(2-CN-Ph)CH ₂	2,6-diMeO-Ph	3-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	4-(PhO)-c-heksilas
CF ₃ CH ₂	3-(2CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-pirimidinilas
2-MeS-Ph	5-PhO-3 piridinilas	5-PhO-2-piridinilas	6-(2-NO ₂ -PhO)-4-pirimidinilas
i-Bu	6-Me-2-piridinilas	6-PhO-2-piridinilas	6-(2-Cl-PhO)-4-pirimidinilas
2-CF ₃ O-Ph	3-CFO-Ph	6-CF-2-piridinilas	6-(2-CF ₃ -PhO)-4-pirimidinilas
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-piridinilas	4,6-diMeO-2-pirimidinilas
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-pirimidinilas	4,6-diMe-2-pirimidinilas
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-pirimidinilas	6-CF ₃ -4-pirimidinilas
3-CF ₃ -Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-piridinilas
3-Cl-2-MePh	4-t-Bu-Ph	4-Me-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-pirimidinilas
3-t-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-pirimidinilas	2-piridinilas
3-NO ₂ -Ph	4-NO ₂ -Ph	2-Ph-4-tiazolilas	6-CF ₃ -2-pirazinilas
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-piridazinilas	5-CF ₃ -3-piridinilas
4-CF-Ph	3-Ph-Ph	5-Me-2-furanilas	3-MeO-2-piridinilas
3,4-diCl-Ph	3,4-diMe-Ph	2,5-diMe-3-tienilas	5-CN-2-piridinilas
3,4-diCF-Ph	3,5-diMe-Ph	3-OCF ₂ H-Ph	6-Me-2-piridinilas
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF ₂ H-PH	

Y = O, A = NMe

<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>
heksilas	4-oktenilas	3-pentinilas	4-PhO-2-piridinilas
PhO(CH ₂) ₃	PhCH=CHCH ₂	PhC≡CCH ₂	(c-propilas)CH ₂
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-pirimidinilas
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-pirimidinilas
2,4-diCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-triCl-Ph	4-EtO-2-pirimidinilas
2-CF ₃ -Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(4-pirimidiniloksi)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)-Ph	3-(2-Et-Ph)-Ph	4-(2-tienilas)Ph
c-heksilas	3,5-diCl-Ph	6-Ph-2-piridinilas	3-(2-piridiniloksi)Ph
4-NO ₂ -Ph	3,5-diCF ₃ -Ph	6-PhO-4-piridinilas	3-piridinilas
PhCH ₂ CH ₂	2-MeO-Ph	3-tieniloksi-Ph	4-(3-Cl-2-piridiniloksi)-Ph
(2-CN-Ph)CH ₂	2,6-diMeO-Ph	3-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	4-(PhO)-c-heksilas
CF ₃ CH ₂	3-(2CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-pirimidinilas
2-MeS-Ph	5-PhO-3 piridinilas	5-PhO-2-piridinilas	6-(2-NO ₂ -PhO)-4-pirimidinilas
i-Bu	6-Me-2-piridinilas	6-PhO-2-piridinilas	6-(2-Cl-PhO)-4-pirimidinilas
2-CF ₃ O-Ph	3-CFO-Ph	6-CF-2-piridinilas	6-(2-CF ₃ -PhO)-4-pirimidinilas
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-piridinilas	4,6-diMeO-2-pirimidinilas
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-pirimidinilas	4,6-diMe-2-pirimidinilas
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-pirimidinilas	6-CF ₃ -4-pirimidinilas
3-CF ₃ -Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-piridinilas
3-Cl-2-MePh	4-t-Bu-Ph	4-Me-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-pirimidinilas
3-t-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-pirimidinilas	2-piridinilas
3-NO ₂ -Ph	4-NO ₂ -Ph	2-Ph-4-tiazolilas	6-CF ₃ -2-pirazinilas
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-piridazinilas	5-CF ₃ -3-piridinilas
4-CF-Ph	3-Ph-Ph	5-Me-2-furanilas	3-MeO-2-piridinilas
3,4-diCl-Ph	3,4-diMe-Ph	2,5-diMe-3-tienilas	5-CN-2-piridinilas
3,4-diCF-Ph	3,5-diMe-Ph	3-OCF ₂ H-Ph	6-Me-2-piridinilas
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF ₂ H-PH	

Y = CH₂O, A = NMe

<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>
heksilas	4-oktenilas	3-pentinilas	4-PhO-2-piridinilas
PhO(CH ₂) ₃	PhCH=CHCH ₂	PhC≡CCH ₂	(c-propilas)CH ₂
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-pirimidinilas
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-pirimidinilas
2,4-diCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-triCl-Ph	4-EtO-2-pirimidinilas
2-CF ₃ -Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(4-pirimidiniloksi)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)-Ph	3-(2-Et-Ph)-Ph	4-(2-tienilas)Ph
c-heksilas	3,5-diCl-Ph	6-Ph-2-piridinilas	3-(2-piridiniloksi)Ph
4-NO ₂ -Ph	3,5-diCF ₃ -Ph	6-PhO-4-piridinilas	3-piridinilas
PhCH ₂ CH ₂	2-MeO-Ph	3-tieniloksi-Ph	4-(3-Cl-2-piridiniloksi)-Ph
(2-CN-Ph)CH ₂	2,6-diMeO-Ph	3-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	4-(PhO)-c-heksilas
CF ₃ CH ₂	3-(2CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-pirimidinilas
2-MeS-Ph	5-PhO-3 piridinilas	5-PhO-2-piridinilas	6-(2-NO ₂ -PhO)-4-pirimidinilas
i-Bu	6-Me-2-piridinilas	6-PhO-2-piridinilas	6-(2-Cl-PhO)-4-pirimidinilas
2-CF ₃ O-Ph	3-CFO-Ph	6-CF-2-piridinilas	6-(2-CF ₃ -PhO)-4-pirimidinilas
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-piridinilas	4,6-diMeO-2-pirimidinilas
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-pirimidinilas	4,6-diMe-2-pirimidinilas
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-pirimidinilas	6-CF ₃ -4-pirimidinilas
3-CF ₃ -Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-piridinilas
3-Cl-2-MePh	4-t-Bu-Ph	4-Me-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-pirimidinilas
3-t-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-pirimidinilas	2-piridinilas
3-NO ₂ -Ph	4-NO ₂ -Ph	2-Ph-4-tiazolilas	6-CF ₃ -2-pirazinilas
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-piridazinilas	5-CF ₃ -3-piridinilas
4-CF-Ph	3-Ph-Ph	5-Me-2-furanilas	3-MeO-2-piridinilas
3,4-diCl-Ph	3,4-diMe-Ph	2,5-diMe-3-tienilas	5-CN-2-piridinilas
3,4-diCF-Ph	3,5-diMe-Ph	3-OCF ₂ H-Ph	6-Me-2-piridinilas
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF ₂ H-PH	

16 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: A = O, G = C, W = O, X = MeO, R² = Me, R³ = R⁴ = H, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir



<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>
heksilas	4-oktenilas	3-pentinilas	4-PhO-2-piridinilas
PhO(CH ₂) ₃	PhCH=CHCH ₂	PhC≡CCH ₂	(c-propilas)CH ₂
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-pirimidinilas
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-pirimidinilas
2,4-diCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-triCl-Ph	4-EtO-2-pirimidinilas
2-CF ₃ -Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(4-pirimidiniloksi)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)-Ph	3-(2-Et-Ph)-Ph	4-(2-tienilas)Ph
c-heksilas	3,5-diCl-Ph	6-Ph-2-piridinilas	3-(2-piridiniloksi)Ph
4-NO ₂ -Ph	3,5-diCF ₃ -Ph	6-PhO-4-piridinilas	3-piridinilas
PhCH ₂ CH ₂	2-MeO-Ph	3-tieniloksi-Ph	4-(3-Cl-2-piridiniloksi)-Ph
(2-CN-Ph)CH ₂	2,6-diMeO-Ph	3-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	4-(PhO)-c-heksilas
CF ₃ CH ₂	3-(2CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-pirimidinilas
2-MeS-Ph	5-PhO-3 piridinilas	5-PhO-2-piridinilas	6-(2-NO ₂ -PhO)-4-pirimidinilas
i-Bu	6-Me-2-piridinilas	6-PhO-2-piridinilas	6-(2-Cl-PhO)-4-pirimidinilas
2-CF ₃ O-Ph	3-CFO-Ph	6-CF-2-piridinilas	6-(2-CF ₃ -PhO)-4-pirimidinilas
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-piridinilas	4,6-diMeO-2-pirimidinilas
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-pirimidinilas	4,6-diMe-2-pirimidinilas
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-pirimidinilas	6-CF ₃ -4-pirimidinilas
3-CF ₃ -Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-piridinilas
3-Cl-2-MePh	4-t-Bu-Ph	4-Me-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-pirimidinilas
3-t-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-pirimidinilas	2-piridinilas
3-NO ₂ -Ph	4-NO ₂ -Ph	2-Ph-4-tiazolilas	6-CF ₃ -2-pirazinilas
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-piridazinilas	5-CF ₃ -3-piridinilas
4-CF-Ph	3-Ph-Ph	5-Me-2-furanilas	3-MeO-2-piridinilas
3,4-diCl-Ph	3,4-diMe-Ph	2,5-diMe-3-tienilas	5-CN-2-piridinilas
3,4-diCF-Ph	3,5-diMe-Ph	3-OCF ₂ H-Ph	6-Me-2-piridinilas
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF ₂ H-PH	

17 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: A = NMe, G = C, W = O, X = MeO, R² = Me, R³ = R⁴ = H, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir



<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>
heksilas	4-oktenilas	3-pentinilas	4-PhO-2-piridinilas
$\text{PhO}(\text{CH}_2)_3$	$\text{PhCH}=\text{CHCH}_2$	$\text{PhC}\equiv\text{CCH}_2$	(c-propilas) CH_2
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-pirimidinilas
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-pirimidinilas
2,4-diCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-triCl-Ph	4-EtO-2-pirimidinilas
2-CF ₃ -Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(4-pirimidiniloksi)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)-Ph	3-(2-Et-Ph)-Ph	4-(2-tienilas)Ph
c-heksilas	3,5-diCl-Ph	6-Ph-2-piridinilas	3-(2-piridiniloksi)Ph
4-NO ₂ -Ph	3,5-diCF ₃ -Ph	6-PhO-4-piridinilas	3-piridinilas
PhCH_2CH_2	2-MeO-Ph	3-tieniloksi-Ph	4-(3-Cl-2-piridiniloksi)-Ph
(2-CN-Ph) CH_2	2,6-diMeO-Ph	3-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	4-(PhO)-c-heksilas
CF ₃ CH ₂	3-(2CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-pirimidinilas
2-MeS-Ph	5-PhO-3 piridinilas	5-PhO-2-piridinilas	6-(2-NO ₂ -PhO)-4-pirimidinilas
i-Bu	6-Me-2-piridinilas	6-PhO-2-piridinilas	6-(2-Cl-PhO)-4-pirimidinilas
2-CF ₃ O-Ph	3-CFO-Ph	6-CF-2-piridinilas	6-(2-CF ₃ -PhO)-4-pirimidinilas
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-piridinilas	4,6-diMeO-2-pirimidinilas
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-pirimidinilas	4,6-diMe-2-pirimidinilas
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-pirimidinilas	6-CF ₃ -4-pirimidinilas
3-CF ₃ -Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-piridinilas
3-Cl-2-MePh	4-t-Bu-Ph	4-Me-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-pirimidinilas
3-t-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-pirimidinilas	2-piridinilas
3-NO ₂ -Ph	4-NO ₂ -Ph	2-Ph-4-tiazolilas	6-CF ₃ -2-pirazinilas
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-piridazinilas	5-CF ₃ -3-piridinilas
4-CF-Ph	3-Ph-Ph	5-Me-2-furanilas	3-MeO-2-piridinilas
3,4-diCl-Ph	3,4-diMe-Ph	2,5-diMe-3-tienilas	5-CN-2-piridinilas
3,4-diCF-Ph	3,5-diMe-Ph	3-OCF ₂ H-Ph	6-Me-2-piridinilas
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF ₂ H-PH	

18 lentelė

Formulės Ijunginiai, kuriuose: A = N, G = N, W = O, X = MeO, R² = Me, R³ = R⁴ = H, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie A,



<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>
heksilas	4-oktenilas	3-pentinilas	4-PhO-2-piridinilas
PhO(CH ₂) ₃	PhCH=CHCH ₂	PhC≡CCH ₂	(c-propilas)CH ₂
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-pirimidinilas
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-pirimidinilas
2,4-diCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-triCl-Ph	4-EtO-2-pirimidinilas
2-CF ₃ -Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(4-pirimidiniloksi)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)-Ph	3-(2-Et-Ph)-Ph	4-(2-tienilas)Ph
c-heksilas	3,5-diCl-Ph	6-Ph-2-piridinilas	3-(2-piridiniloksi)Ph
4-NO ₂ -Ph	3,5-diCF ₃ -Ph	6-PhO-4-piridinilas	3-piridinilas
PhCH ₂ CH ₂	2-MeO-Ph	3-tieniloksi-Ph	4-(3-Cl-2-piridiniloksi)-Ph
(2-CN-Ph)CH ₂	2,6-diMeO-Ph	3-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	4-(PhO)-c-heksilas
CF ₃ CH ₂	3-(2CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-pirimidinilas
2-MeS-Ph	5-PhO-3 piridinilas	5-PhO-2-piridinilas	6-(2-NO ₂ -PhO)-4-pirimidinilas
i-Bu	6-Me-2-piridinilas	6-PhO-2-piridinilas	6-(2-Cl-PhO)-4-pirimidinilas
2-CF ₃ O-Ph	3-CFO-Ph	6-CF-2-piridinilas	6-(2-CF ₃ -PhO)-4-pirimidinilas
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-piridinilas	4,6-diMeO-2-pirimidinilas
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-pirimidinilas	4,6-diMe-2-pirimidinilas
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-pirimidinilas	6-CF ₃ -4-pirimidinilas
3-CF ₃ -Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-piridinilas
3-Cl-2-MePh	4-t-Bu-Ph	4-Me-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-pirimidinilas
3-t-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-pirimidinilas	2-piridinilas
3-NO ₂ -Ph	4-NO ₂ -Ph	2-Ph-4-tiazolilas	6-CF ₃ -2-pirazinilas
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-piridazinilas	5-CF ₃ -3-piridinilas
4-CF-Ph	3-Ph-Ph	5-Me-2-furanilas	3-MeO-2-piridinilas
3,4-diCl-Ph	3,4-diMe-Ph	2,5-diMe-3-tienilas	5-CN-2-piridinilas
3,4-diCF-Ph	3,5-diMe-Ph	3-OCF ₂ H-Ph	6-Me-2-piridinilas
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF ₂ H-PH	

Y = CH₂S

<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>
heksilas	4-oktenilas	3-pentinilas	4-PhO-2-piridinilas
PhO(CH ₂) ₃	PhCH=CHCH ₂	PhC≡CCH ₂	(c-propilas)CH ₂
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-pirimidinilas
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-pirimidinilas
2,4-diCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-triCl-Ph	4-EtO-2-pirimidinilas
2-CF ₃ -Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(4-pirimidiniloksi)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)-Ph	3-(2-Et-Ph)-Ph	4-(2-tienilas)Ph
c-heksilas	3,5-diCl-Ph	6-Ph-2-piridinilas	3-(2-piridiniloksi)Ph
4-NO ₂ -Ph	3,5-diCF ₃ -Ph	6-PhO-4-piridinilas	3-piridinilas
PhCH ₂ CH ₂	2-MeO-Ph	3-tieniloksi-Ph	4-(3-Cl-2-piridiniloksi)-Ph
(2-CN-Ph)CH ₂	2,6-diMeO-Ph	3-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	4-(PhO)-c-heksilas
CF ₃ CH ₂	3-(2CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-pirimidinilas
2-MeS-Ph	5-PhO-3 piridinilas	5-PhO-2-piridinilas	6-(2-NO ₂ -PhO)-4-pirimidinilas
i-Bu	6-Me-2-piridinilas	6-PhO-2-piridinilas	6-(2-Cl-PhO)-4-pirimidinilas
2-CF ₃ O-Ph	3-CFO-Ph	6-CF-2-piridinilas	6-(2-CF ₃ -PhO)-4-pirimidinilas
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-piridinilas	4,6-diMeO-2-pirimidinilas
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-pirimidinilas	4,6-diMe-2-pirimidinilas
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-pirimidinilas	6-CF ₃ -4-pirimidinilas
3-CF ₃ -Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-piridinilas
3-Cl-2-MePh	4-t-Bu-Ph	4-Me-2-pirimidinilas	4-CF ₃ -2-pirimidinilas
3-t-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-pirimidinilas	2-piridinilas
3-NO ₂ -Ph	4-NO ₂ -Ph	2-Ph-4-tiazolilas	6-CF ₃ -2-pirazinilas
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-piridazinilas	5-CF ₃ -3-piridinilas
4-CF-Ph	3-Ph-Ph	5-Me-2-furanilas	3-MeO-2-piridinilas
3,4-diCl-Ph	3,4-diMe-Ph	2,5-diMe-3-tienilas	5-CN-2-piridinilas
3,4-diCF-Ph	3,5-diMe-Ph	3-OCF ₂ H-Ph	6-Me-2-piridinilas
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF ₂ H-PH	

19 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: A = N, G = N, W = O, X = MeO, R² = Me, R³ = R⁴ = H, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie A, ir



<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>	<u>Z</u>
2-Me-Pb	3-Me-Pb	3-CF ₃ -Ph	3-Cl-Ph
4-Cl-Ph	4-CF ₃ -Ph	2,5-diMe-Pb	3,5-diCl-Pb

20 lentelė

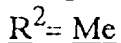
Formulės I junginiai, kuriuose: A = N, G = N, W = O, X = MeO, Z = 3-CF₃-Ph, R² = Me, R³ = R⁴ = H, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie A, ir



<u>R⁷</u>	<u>R⁷</u>	<u>R⁷</u>	<u>R⁷</u>
CF ₃	OCH ₂ CF ₃	Et	n-Pr
Cl	MeO	EtO	MeS

21 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: A = O, G = C, W = O, X = MeO, R³ = R⁴ = H, Y = CH₂ON = C(R⁷), dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir



<u>R⁷</u>	<u>Z</u>	<u>R⁷</u>	<u>Z</u>
c-propilas	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-Ph	c-propilas	3,4-(OCHFCH ₂ O)-Ph
c-propilas	3,4-(OCF ₂ O)-Ph	c-propilas	Ph
c-propilas	4-CF ₃ -Ph	c-propilas	3-CF ₃ -Ph
c-propilas	4-Cl-Ph	c-propilas	3-Cl-Ph
c-propilas	2-Me-Ph	c-propilas	3-OCF ₃ -Ph
CF ₃	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-Ph	CF ₃	3,4-(OCHFCH ₂ O)-Ph
CF ₃	3,4-(OCF ₂ O)-Ph	CF ₃	Ph
CF ₃	4-CF ₃ -Ph	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
CF ₃	4-Cl-Ph	CF ₃	3-Cl-Ph
CF ₃	2-Me-Ph	CF ₃	3-OCF ₃ -Ph
Et	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-Ph	Et	3,4-(OCHFCH ₂ O)-Ph
Et	3,4-(OCF ₂ O)-Ph	Et	Ph
Et	4-CF ₃ -Ph	Et	3-CF ₃ -Ph
Et	4-Cl-Ph	Et	3-Cl-Ph
Et	2-Me-Ph	Et	3-OCF ₃ -Ph

22 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: A=NMe, G=C, W=O, X=MeO, $R^3=R^4=H$, Y=CH₂ON=C(R⁷), dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir

$R^2 = \text{Me}$

R^7	Z	R^7	Z
c-propilas	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-Ph	c-propilas	3,4-(OCHFCH ₂ O)-Ph
c-propilas	3,4-(OCF ₂ O)-Ph	c-propilas	Ph
c-propilas	4-CF ₃ -Ph	c-propilas	3-CF ₃ -Ph
c-propilas	4-Cl-Ph	c-propilas	3-Cl-Ph
c-propilas	2-Me-Ph	c-propilas	3-OCF ₃ -Ph
CF ₃	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-Ph	CF ₃	3,4-(OCHFCH ₂ O)-Ph
CF ₃	3,4-(OCF ₂ O)-Ph	CF ₃	Ph
CF ₃	4-CF ₃ -Ph	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
CF ₃	4-Cl-Ph	CF ₃	3-Cl-Ph
CF ₃	2-Me-Ph	CF ₃	3-OCF ₃ -Ph
Et	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-Ph	Et	3,4-(OCHFCH ₂ O)-Ph
Et	3,4-(OCF ₂ O)-Ph	Et	Ph
Et	4-CF ₃ -Ph	Et	3-CF ₃ -Ph
Et	4-Cl-Ph	Et	3-Cl-Ph
Et	2-Me-Ph	Et	3-OCF ₃ -Ph

23 lentelė

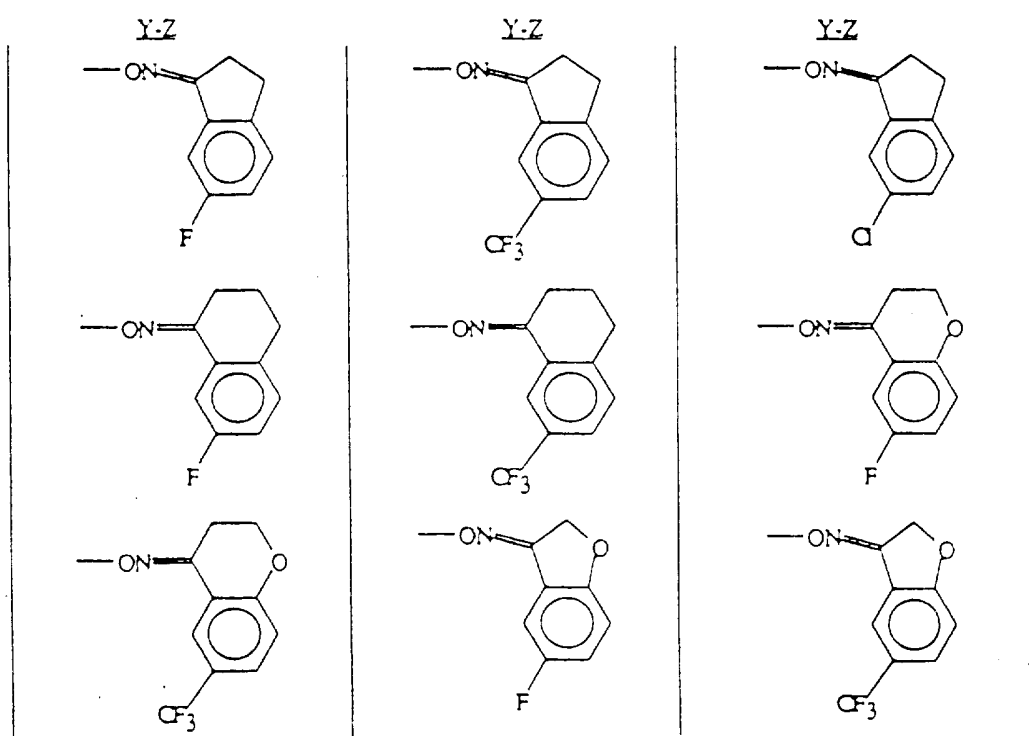
Formulės I junginiai, kuriuose: A=N, G=N, W=O, X=MeO, $R^3=R^4=H$, Y=CH₂ON=C(R⁷), dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie A, ir

$\underline{R^2} = \underline{Me}$

$\underline{R^7}$	$\underline{Z}$	$\underline{R^7}$	$\underline{Z}$
c-propilas	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-Ph	c-propilas	3,4-(OCHF ₂ CF ₂ O)-Ph
c-propilas	3,4-(OCF ₂ O)-Ph	c-propilas	Ph
c-propilas	4-CF ₃ -Ph	c-propilas	3-CF ₃ -Ph
c-propilas	4-Cl-Ph	c-propilas	3-Cl-Ph
c-propilas	2-Me-Ph	c-propilas	3-OCF ₃ -Ph
CF ₃	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-Ph	CF ₃	3,4-(OCHF ₂ CF ₂ O)-Ph
CF ₃	3,4-(OCF ₂ O)-Ph	CF ₃	Ph
CF ₃	4-CF ₃ -Ph	CF ₃	3-CF ₃ -Ph
CF ₃	4-Cl-Ph	CF ₃	3-Cl-Ph
CF ₃	2-Me-Ph	CF ₃	3-OCF ₃ -Ph
Et	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-Ph	Et	3,4-(OCHF ₂ CF ₂ O)-Ph
Et	3,4-(OCF ₂ O)-Ph	Et	Ph
Et	4-CF ₃ -Ph	Et	3-CF ₃ -Ph
Et	4-Cl-Ph	Et	3-Cl-Ph
Et	2-Me-Ph	Et	3-OCF ₃ -Ph

24 lentelė

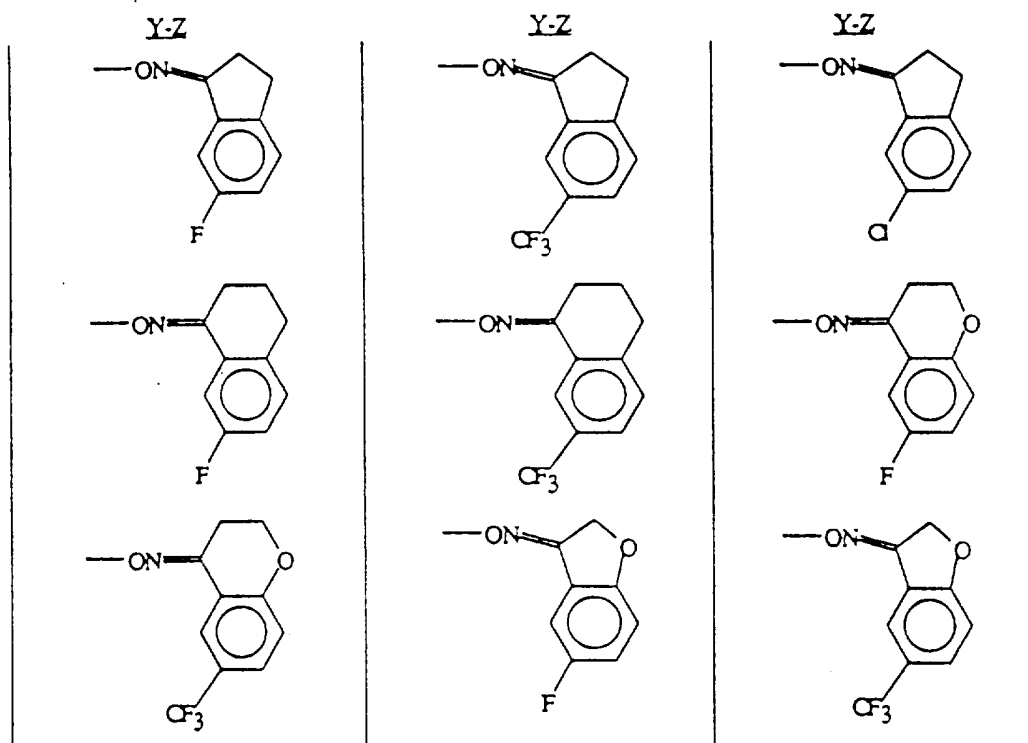
Formulės I junginiai, kuriuose: A=O, G=C, W=O, X=MeO, R³=R⁴=H, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir

 $\underline{R^2} = \underline{Me}$ 

25 lentelė

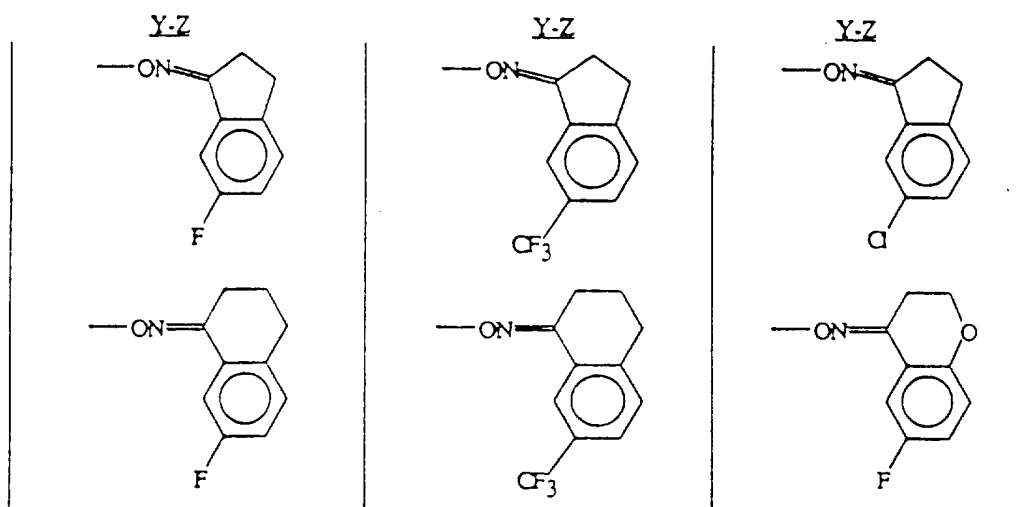
Formulės I junginiai, kuriuose: A=NMe, G=C, W=O, X=MeO, $R^3=R^4=H$, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G, ir

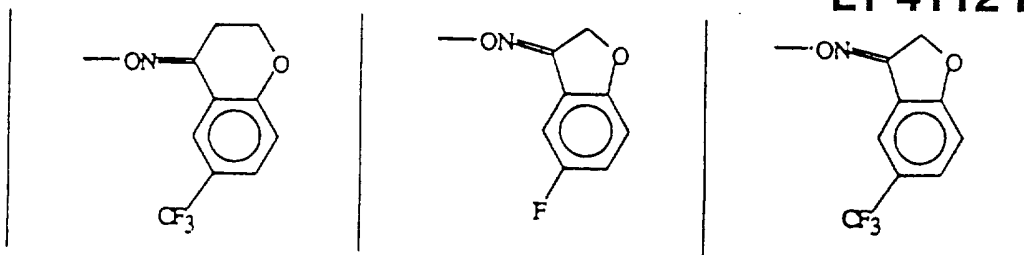
$R^2 = \text{Me}$

26 lentelė

Formulės I junginiai, kuriuose: A=N, G=N, W=O, X=MeO, $R^3=R^4=H$, dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie A, ir

$R^2 = \text{Me}$





Receptūros/panaudojimas

Šio išradimo junginiai paprastai bus naudojami receptūrose su agrotechniškai tinkamomis kompozicijomis. Fungicidinės šio išradimo kompozicijos turi efektyvų kiekį bent vieno formulės I junginio, kaip apibrėžta aukščiau, ir bent 1 (a) paviršiaus aktyvią medžiagą, (b) organinį tirpiklį ir (c) bent vieną kietą arba skystą tirpiklį. Naudingos receptūros gali būti paruoštos sutartais būdais. Jie apima dulkes, granules, žirnelius, tirpalus, suspensijas, emulsijas, drėkstančius miltelius, emulsijų koncentratų, sausas takias medžiagas ir panašiai. Purškiamos receptūros gali būti išplėtos į tinkamą terpę ir panaudotos išpurškiančiuose tūriuose nuo maždaug vieno iki kelių šimtų litrų hektarui. Didelio pajėgumo kompozicijos yra pirmiausiai panaudojamos kaip tarpinės būsimai receptūrai. Receptūros turi efektyvų kiekį aktyviojo ingrediento, skiediklio ir paviršiaus aktyvios medžiagos, kurie sudaro 100 svorio %, o jų kiekiai parenkami iš lentelėje nurodytų intervalų.

	Svorio procentai		
	Aktyvusis ingredientas	Skiediklis	Paviršiaus aktyvioji medžiaga
Drėkstantys milteliai	5-90	0-74	1-10
Alyvinės suspensijos, emulsijos, tirpalai (jų tarpe gali būti emulsinantys koncentratai)	5-50	40-95	0-15
Dulkės	1-25	70-99	0-5
Granulės, jaukai ir žirneliai	0,01-99	5-99.99	0-15
Didelio pajėgumo kompozicijos	90-99	0-10	0-2

Būdingi kieti skiedikliai yra aprašyti Watkins, et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey. Būdingi skysti skiedikliai ir tirpikliai yra aprašyti Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, (1950). McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey, taip pat kaip ir Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, (1964) duotas sąrašas paviršiaus aktyvių medžiagų ir nurodyti vartotojai. Visos receptūros gali turėti nežymius kiekius priedų, sumažinančių putojimą, sukepimą, koroziją, mikrobiologinį augimą ir panašius.

Šių kompozicijų sudarymo būdai yra gerai žinomi. Tirpalai, sudaromi paprastai sumaišant ingredientus. Smulkių dalelių kietos kompozicijos sudaromos sumaišant ir, paprastai, sumalant malūne sausiai arba panaudojant skysčio energiją. Vandenyje disperguojančios granulės gali būti pagamintos sukepinant smulkių miltelių kompozicijas, žiūrėti, pavyzdžiui, Cross et al., *Pesticide Formulations*, Washington, D.C., (1988), pp 251-259. Suspensijos yra pagaminamos šlapias susmulkinant; žiūrėti, pavyzdžiui, US patentą Nr. 3 060 084. Granulės ir žirneliai gali būti pagaminti purškiant aktyvią medžiagą ant pagamintų granuliuotų nešėjų arba sukepinimo technika. Žiūrėti Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147-148, Perry's *Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, (1963), pp 8-57 ir toliau, taip pat WO 91/13546. Žirneliai gali būti pagaminti US patente Nr. 4 172 714 aprašytu būdu. Vandenyje disperguojančios ir vandenyje tirpstančios granulės gali būti paruoštos kaip aprašyta DE patente Nr. 3 246 493.

Pilnesnei informacijai apie receptūrų mokslą žiūrėti patentus: US Nr. 3 235 361, nuo 6 stulpelio 16 eilutės iki 7 stulpelio 19 eilutės ir nuo 10 iki 41 pavyzdžius; US 3 309 192 nuo 5 stulpelio 43 eilutės iki 7 stulpelio 62 eilutės ir 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 ir 169-182 pavyzdžius; US 2 891 855 nuo 3 stulpelio 66 eilutės iki 5 stulpelio 17 eilutės ir 1-4 pavyzdžius; taip pat Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, (1961), pp 81-96; ir Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, (1989).

Tolimesniuose pavyzdžiuose visos procentinės sudėtys yra masės procentinės dalys ir visos receptūros yra paruoštos žinomais būdais. 1 junginys nurodytas rodiklių A lentelėje, pateiktoje toliau.

A pavyzdys

Drėkstantys milteliai

1 junginys	65,0 %
dodecilfenolpolietilenglikolio eteris	2,0 %
natrio ligninsulfonatas	4,0 %
natrio silikoaluminatas	6,0 %
montmorilonitas (kalcinuotas)	23,0 %

B pavyzdys

Granulė

1 junginys	10,0 %
atapulgito granulės (mažai laki medžiaga, 0,71/0,30 mm; U.S. sieto Nr. 25-50 akutės)	90,0 %

C pavyzdysPresuoti milteliai

1 junginys	25,0 %
bevandenis natrio sulfatas	10,0 %
nevalytas kalcio lignosulfonatas	5,0 %
natrio alkilnaftalensulfonatas	1,0 %
kalcio/magnio bentonitas	59,0 %

D pavyzdysEmulsinis koncentratas

1 junginys	20,0 %
alyvoje tirpių sulfonatų ir polioksi- etilenų eterių mišinys	10,0 %
izoforonas	70,0 %

Šio išradimo junginiai yra naudingi kaip agentai, apsaugojantys augalus nuo ligų. Šis išradimas toliau apima augalų ligų, kurių priežastimi yra grybeliniai augalų patogenai, priežiūros būdus, apimančius panaudojimą augalui arba jo daliai arba sėklai arba sėjinukui efektyvaus kiekio I formulės junginio arba fungicidinės kompozicijos, turinčios šio junginio. Šio išradimo junginiai ir kompozicijos leidžia kontroliuoti ligas, sukeltas plataus spektro grybelinių augalų ligų sukėlėjų iš Basidiomycete, Ascomycete, Oomycete ir Deuteromycete klasių. Jie efektyviai veikia platų spektrą augalų ligų, ypač daržovių, lauko augalų, javų ir pasėlių lapų ornamentškumą sukeliančias ligas. Tokie ligų sukėlėjai yra *Plasmopara viticola*, *Phytophthora infestans*, *Peronospora tabacina*, *Pseudoperonospora cubensis*, *Pythium aphanidermatum*, *Alternaria brassicae*, *Septoria nodorum*, *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Cercospora beticola*, *Botrytis cinerea*, *Monilinia fructicola*, *Pyricularia oryzae*, *Podosphaera leucotricha*, *Venturia inaequalis*, *Erysiphe graminis*, *Uromyces necator*, *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis*, *Hemileia vastatrix*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia arachidis*, *Rhizoctonia solani*, *Sphaerotheca Fuliginea*, *Fusarium oxysporum*, *Verticillium dahliae*, *Pythium aphanidermatum*, *Phytophthora megasperma* ir kitos atmainos ir rūšys, glaudžiai susijusios su šiais patogenais.

Šio išradimo junginiai taip pat gali būti sumaišyti su vienu arba daugiau kitais insekticidais, fungicidais, nematocidais, bakteriocidais, akaricidais, repelentais, atraktantais, feromonais, maitinimo stimulatoriais ir kitais biologiškai aktyviais junginiais, sudarant daugiakomponentinį pesticidą, turintį tokį pat platų agrokultūrinės apsaugos spektrą. Kitų agrokultūrinių apsaugos priemonių pavyzdžiai, su kuriais išradimo junginiai gali būti naudojami, yra: insekticidai, tokie kaip acefatas,

avermektinas B, azinfosmetilas, bifentrinas, bifenatas, buprofezinas, karbofuranas, chlordimeformas, chlorpirifosas, ciflutrinas, deltametrinas, diazinonas, diflubenzuronas, dimetoatas, esfenvaleratas, fenpropatrinas, fenvaleratas, fipronilas, flucitrinatas, flufenproksas, fluvalinatas, fonofosas, izofenfosas, malationas, metaldehidas, meta-midofosas, metidationas, metomilas, metoprenas, metoksichoras, monokrotofosas, oksamilas, parasionmetilas, permetrinas, foratas, fosalonas, fosometas, fosfamidonas, pirimikarbas, profenofosas, rotenonas, sulprofosas, terbufosas, tetrachlorvinfosas, tiodikarbas, tralometrinas, trichlorfonas, ir triflumuronas; fungicidai, tokie kaip benomilas, blasticidinas S, bromuconazolas, kaptafolas, kaptanas, karbendazimas, chloronebas, chlorotalonilas, vario oksichloridas, vario druskos, cimoksanilas, ciprokonazolas, dichloranas, diklobutazolas, diklomezinas, difenokonazolas, dinikonazolas, dodinas, edifenfosas, epoksikonazolas, fenarimolas, fenbukonazolas, fenpropidinas, fenpropimorfos, flukvinkonazolas, flusilazolas, flutolanilas, flutriafolas, folpetas, furalaksilas, heksakonazolas, ipkonazolas, iprobenfosas, iprodionas, izoprotiolanas, kasugamicinas, mankozebas, manebas, mepronilas, metalaksilas, metkonazolas, miklobutanilas, neoasozinas, oksadiksilas, penconazolas, pensikuronas, fosetilas-Al, probenzolas, prochlorazas, propikonazolas, pirifenoksas, pirokvilonas, sulfuras, tebukonazolas, tetrakonazolas, tiabendazolas, tiofanatometilas, tiuramas, triadimefonas, triadimenolas, tričiklazolas, unikonzolas, validamicinas ir vinkozolinas; nematocidai, tokie kaip aldoksikarbas, fenamifosas ir fostietanas; baktericidai, tokie kaip oksitetraciklinas, streptomycinas ir tribazis vario sulfatas; akaricidai, tokie kaip amitrazas, binapakrilas, chlorobenzilatas, ciheksatinas, dikofolas, dienochloras, fenbutatinas, oksidas, heksitiazoksas, oksitiokvinoksas, propargitas ir tebufenpiradas; ir biologiniai agentai, tokie kaip Bacillus thuringiensis ir baculovirus.

Neabejotina, kad atskirais atvejais suderinimas su kitais fungicidais, turinčiais panašų veikimo spektrą, bet skirtingą veikimo pobūdį, bus ypatingai naudingas pasipriešinimo valdymui.

Augalų ligų priežiūra paprastai yra vykdoma panaudojant šio išradimo junginio efektyvų kiekį arba prieš, arba po užkrėtimo augalo daliai, kurią reikia apsaugoti, pavyzdžiui, šaknims, stiebams, vaisiui, sėkloms, gumbams arba svogūnėliams, arba terpei (dirvožemiui arba smėliui), kuriuose auga apsaugomi augalai. Junginiai taip pat gali būti panaudoti sėklai, kad būtų apsaugota sėkla ir sėjinukas.

Šių junginių vartojimo normos gali priklausyti nuo daugelio aplinkos faktorių ir nustatomos priklausomai nuo esančių naudojimo sąlygų. Lapija paprastai apsaugoma, kai apdorojimui skirtas aktyvus ingradiento kiekis yra nuo mažiau kaip 1 g/ha iki 5000 g/ha. Sėkla ir sėjinukai gali būti normaliai apsaugoti, kai sėkla yra apdorojama kiekiu nuo 0,1 g iki 10 g kilogramui sėklos.

Toliau pateikti BANDYMAI parodo šio išradimo junginių poveikio specifiniams patogenams veiksmingumą. Junginių duodama apsaugos nuo ligų sukėlėjų kontrolė yra neribota toliau pateiktoms rūšims. Žiūrėti junginio rūšių Rodiklių A-D Lenteles.

Bandomieji junginiai pirmiausia buvo ištirpinti acetone kiekiu, lygiu 3 % galutinio tūrio, ir po to suspenduoti 200 mil. dal. koncentracijos gryname vandenyje, turinčiame 250 mil. dal. paviršiaus aktyvios medžiagos Trem® 014 (polihidroksilinis alkoholio esteris). Gauta bandomoji suspensija buvo panaudota toliau pateiktuose bandymuose.

A BANDYMAS

Bandomoji suspensija buvo išpurkšta ant sudaigintų kviečių. Kitą dieną daigai buvo apkrėsti *Erysiphe graminis f. sp. tritici* (pilkosios miltligės milteliai kviečių ligos agentas) sporų dulkelėmis ir patalpinta į auginimo kambarį 20°C temperatūroje 7 dienų laikotarpiui, po to buvo įvertintas ligos stovis.

B BANDYMAS

Bandomoji suspensija buvo išpurkšta ant sudaigintų kviečių daigų. Kitą dieną daigai buvo apkrėsti *Puccinia recondita* (kviečių lapų rūdis sukeliantis agentas) sporų suspensija ir inkubuojami prisotintoje aplinkoje 20°C temperatūroje 24 valandas, po to mėginys buvo perkeltas į auginimo kambarį, kuriame buvo 20°C temperatūra ir laikomi 6 dienas, o po to buvo įvertintas ligos stovis.

C BANDYMAS

Bandomoji suspensija buvo išpurkšta ant sudaigintų ryžių daigų. Kitą dieną daigai buvo apkrėsti *Pyricularia oryzae* (ryžių daigų susirgimo agentas) sporų suspensija ir inkubuojami prisotintoje atmosferoje 27°C temperatūroje 24 valandas, po to perkelti į auginimo kambarį, kur 30°C temperatūroje buvo laikomi 5 dienas, po to buvo įvertintas ligos stovis.

D BANDYMAS

Bandomoji suspensija buvo išpurkšta ant sudaigintų pomidorų daigų. Kitą dieną daigai buvo apkrėsti *Phytophthora infestans* (bulvių ir pomidorų vėlyvojo amaro ligos agentas) sporų suspensija ir inkubuojami prisotintoje aplinkoje 20°C temperatūroje 24 valandas, po to perkelti į augimo kambarį, kur 20°C temperatūroje buvo laikomi 5 dienas, po to buvo įvertintas ligos stovis.

E BANDYMAS

Bandomoji suspensija buvo išpurkšta ant sudaigintų vynuogių sodinukų. Kitą dieną sodinukai buvo apkrėsti *Plasmopara viticola* (vynuogių netikrosios miltligės agentas) sporų suspensija ir inkubuojami prisotintoje aplinkoje 20°C temperatūroje 24 valandoms, po to perkelti į augimo kambarį, kur 20°C temperatūroje buvo laikomi 6

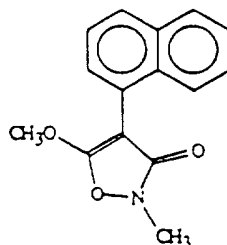
valandoms, po to perkelti į augimo kambarį, kur 20°C temperatūroje buvo laikomi 6 dienas, po to patalpinti į prisotintą aplinką 20°C temperatūroje 24 valandoms, po to buvo įvertintas ligos stovis.

F BANDYMAS

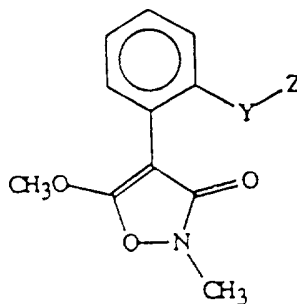
Bandomoji suspensija buvo išpurkšta ant sudaigintų agurkų daigų. Kitą dieną daigai buvo apkrėsti *Botrytis cinerea* (daugelio kultūrų pilkojo pelėsio priežastinis agentas) sporų suspensija ir inkubuojami prisotintoje aplinkoje 20°C temperatūroje 48 valandas, po to perkelti į auginimo kambarį, kur buvo laikomi 20°C temperatūroje 5 dienas, po to buvo įvertintas ligos stovis.

RODIKLIŲ A LENTELE

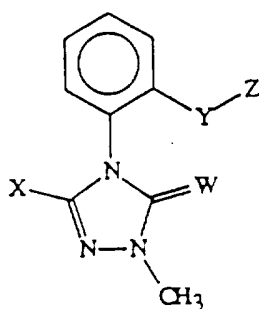
<u>Junginys</u>	<u>lyd. temp. (°C)</u>
	117-120



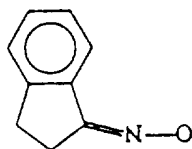
RODIKLIŲ B LENTELE



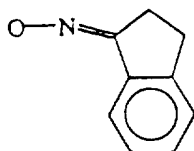
<u>Junginys</u>	<u>Y</u>	<u>Z</u>	<u>lyd. temp.(°C)</u>
2	O	2-Me-Ph	alyva*
3	O	CH ₂ -Ph	alyva*
4	-	Me	alyva*
5	CH ₂ O	2-Me-Ph	alyva*

RODIKLIŲ C LENTELĖ

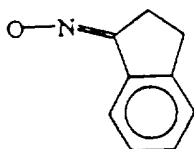
<u>Junginys</u>	<u>W</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>Z</u>	<u>lyd. temp.</u> (°C)
6	O	MeS	O	Ph	129-130
7	O	MeO	O	Me	123-126
8	O	MeO	-	Me	95-97
9	O	MeS	-	Me	95-97
10	O	Cl	-	Me	99-100
11	O	MeO	O	Ph	88-91
12	O	Cl	O	2-Me-Ph	88-96
13	O	MeO	CH ₂ O	2-Me-Ph	110-113
14	O	EtO	CH ₂ O	2-Me-Ph	alyva*
15	O	MeS	CH ₂ O	2-Me-Ph	80-88
16	O	OCH ₂ C=CH	CH ₂ O	2-Me-Ph	122-130
17	O	Cl	CH ₂ ON=C(Me)	4-Me-Ph	alyva*
18	O	MeO	CH ₂ ON=C(Me)	4-Me-Ph	116-118
19	O	MeS	CH ₂ ON=C(Me)	4-Me-Ph	alyva*
20	O	Cl			alyva



21	S	MeS	O	Ph	alyva*
22	O	MeO			126-136



23	O	Cl	CH ₂ ON=C(H)	Ph	alyva*
24	O	MeS			alyva*



25	O	Cl	CH ₂ O	3-(OPhO-Ph	alyva*
26	O	MeO	CH ₂ O	3-(OPhO-Ph	alyva*
27	O	MeO	CH ₂ ON=C(H)	Ph	101-104
28	O	MeS	CH ₂ O	3-(OPhO-Ph	95-100
29	O	Cl	CH ₂ S	2-Me-Ph	106-109
30	O	MeO	CH ₂ S	2-Me-Ph	115-118
31	O	MeS	CH ₂ S	2-Me-Ph	82-86
32	O	Cl	CH ₂ S	2-benzthiazolas	95-97
33	O	MeOl	C=C	Ph	164-166
34	O	MeO	CH ₂ ON=C(Me)	4-Br-Ph	115-120
35	O	Cl	CH ₂ ON=C(Me)	4-Br-Ph	derva*
36	O	Cl	CH ₂ O	3-(benzoilas)-Ph	alyva*
37	O	MeS	CH ₂ ON=C(Me)	4-Br-Ph	117-122
38	O	MeO	CH ₂ O	3-(benzoilas)-Ph	alyva*
39	O	Cl	CH ₂ ON=CH ₂	4-Cl-Ph	alyva*

40	O	Cl	CH ₂ ON=C(Me)	3-piperonilas	alyva
41	O	MeO	CH=NOCH ₂	4-Cl-Ph	alyva
42	O	MeO	CH ₂ ON=C(Me)	3-piperonilas	alyva
43	O	Cl	O	4-(6-Oph)-1,3 pirimidinas	alyva
44	O	MeO	CH ₂ S	2-benzthiazolas	95-97
45	O	MeO	CH ₂ ON=C(Me)	2-Me-Ph	alyva
46	O	MeO	CH ₂ ON=C(Me)	4-CF ₃ -Ph	138-144
47	O	MeO	CH ₂ ON=C(Me)	Ph	alyva
48	O	MeO	CH ₂ ON=C(Me)	Ph	alyva
49	O	MeO	CH ₂ ON=C(Me)	3-Me-Ph	alyva
50	O	MeO	CH ₂ ON=C(Me)	4-MeO -Ph	alyva
51	O	MeO	CH ₂ ON=C(Me)	3-Cl-Ph	alyva
52	O	MeO	CH ₂ ON=C(Me)	Ph	alyva
53	O	MeO	CH=NOCH ₂	3-Me-Ph	alyva

* ¹H MBR reikšmės žiūrėti Indeksų D lentelėje .

RODIKLIŲ D LENTELE

Junginio ¹H MBR reikšmės (200MHz, CDCl₃ tirpalas)

Nr.

2	δ 7.51(dd,1H), 7.27(dt,1H), 7.17(m,2H), 6.97(dd,1H), 6.6(m,3H), 3.92(s,3H), 3.74(s,3H), 3.33(s,3H)
3	δ 7.32(m,7H), 6.99(m,2H), 5.08(s,2H), 3.84(s,3H), 3.42(s,3H)
4	δ 7.25(m,4H), 3.98(s,3H), 3.45(s,3H), 2.30(s,3H)
5	δ 7.61(d,1H), 7.35(m,3H), 7.11(m,2H), 6.84(t,2H), 5.12(s,2H), 3.96(s,3H), 3.415(s,3H), 2.24(s,3H)
14	δ 7.65(d,1H), 7.45(m,2H), 7.23(m,1H), 7.10(m,2H), 6.82(t,1H), 6.78(d,1H), 5.08(s,2H), 4.29(m,2H), 3.41(s,3H), 2.24(s,3H), 1.31(t,3H)
17	δ 7.6-7.45(m,5H), 7.20(m,1H), 7.14(d,2H), 5.27(d,1H), 5.16(d,1H), 3.46(s,3H), 2.34(s,3H), 2.16(s,3H)
19	δ 7.6(d,1H), 7.5(m,3H), 7.4(t,1H), 7.25(m,1H), 7.15(d,2H), 5.26(d,1H), 5.20(d,1H), 3.48(s,3H), 2.41(s,3H), 2.43(s,3H), 2.18(s,3H)
20	δ 7.62(m,2H), 7.5(m,2H), 7.35-7.2(m,4H), 5.25(d,1H), 5.15(d,1H), 3.48(s,3H), 3.02(m,2H), 2.85(m,2H)

- 21 δ 7.42(m,2H), 7.10(m,1H), 7.06(m,3H), 6.99(t,1H),
6.68(d,2H), 3.37(s,3H), 2.51(s,3H)
- 23 δ 8.01(s,1H), 7.61(d,1H), 7.52(m,4H), 7.35(m,3H),
7.25(d,1H), 5.23(d,1H), 5.15(d,1H), 3.49(s,3H)
- 24 δ 7.6(m,2H), 7.5-7.4(m,3H), 7.3-7.2(m,3H), 5.24(d,1H),
5.20(d,1H), 3.48(s,3H), 2.40(s,3H)
- 25 δ 7.6-7.4(m,4H), 7.35(m,2H), 7.2(m,2H), 7.0(d,2H),
6.6(m,3H), 5.04(d,1H), 5.00(d,1H), 3.45(s,3H)
- 26 δ 7.6(d,1H), 7.45(m,2H), 7.33(t,2H), 7.19(m,2H),
7.10(t,1H), 7.01(d,2H), 6.6(m,3H), 5.03(m,2H), 3.87(s,3H),
3.39(s,3H)
- 35 δ 7.6-7.4(m,7H), 7.23(d,1H) 5.28(d,1H), 5.17(d,1H),
3.46(s,3H), 2.14(s,3H)
- 36 δ 7.80(d,2H), 7.65-7.45(m,6H), 7.36(d,2H), 7.30(m,1H),
7.25(m,1H), 7.10(t,1H), 5.15(d,1H), 5.10(d,1H), 3.45(s,2H)
- 38 δ 7.77(d,2H), 7.6(m,2H), 7.47(m,4H), 7.35(m,3H),
7.25(m,1H), 7.10(m,1H), 5.13(d,1H), 5.12(d,1H),
3.89(s,3H), 3.38(s,3H)
- 39 δ 8.03(s,1H), 7.70(d,1H), 7.53(m,2H), 7.35-7.25(m,5H),
5.06(s,2H), 3.46(s,3H)
- 40 δ 7.6-7.5(m,3H), 7.24(m,1H), 7.13(s,1H), 7.02(d,1H),
6.78(d,1H), 5.96(s,2H), 5.26(d,1H), 5.14(d,1H), 3.48(s,3H),
2.13(s,3H),
- 41 δ 8.04(s,1H), 7.8(m,1H), 7.45(m,2H), 7.35-7.25(m,5H),
5.10(s,2H), 3.86(s,3H), 3.41(s,3H)
- 42 δ 7.58(m,1H), 7.43(m,2H), 7.25(m,1H), 7.15(m,1H),
7.02(d,1H), 6.76(d,1H), 5.96(s,2H), 5.22(d,1H), 5.18(d,1H),
3.89(s,3H), 3.42(s,3H), 2.15(s,3H)
- 43 δ 8.04(s,1H), 7.6(m,1H), 7.5-7.4(m,5H), 7.3(d,1H),
7.18(m,2H), 6.38(s,1H), 3.45(s,3H)
- 45 δ 7.55(d,1H), 7.40(m,3H), 7.20(m,4H), 5.21(d,1H),
3.87(s,3H), 3.42(s,3H), 2.24(s,3H)
- 47 δ 7.6-7.2(m,9H), 5.4-5.2(m,2H), 3.87, 3.83(s,3H), 3.41,
3.40(s,3H)
- 48 δ 7.6(m,3H), 7.44(m,2H), 7.35(m,3H), 7.25(m,1H),
5.26(d,1H), 5.22(d,1H), 3.88(s,3H), 3.49(s,3H), 2.20(s,3H)

- 49 δ 7.5(d,1H), 7.40(m,4H), 7.23(m,2H), 7.18(d,1H),
5.26(d,1H), 5.21(d,1H), 3.88(s,3H), 3.41(s,3H), 2.36(s,3H),
2.19(s,3H)
- 50 δ 7.56(m,3H), 7.45(m,2H), 7.25(m,1H), 6.86(d,2H),
5.24(d,1H), 5.19(d,1H), 3.88(s,3H), 3.81(s,3H), 3.41(s,3H),
2.17(s,3H)
- 51 δ 7.5(m,2H), 7.45(m,3H), 7.3(m,3H), 5.27(d,1H),
5.22(d,1H), 3.89(s,3H),
- 52 δ 8.02, 8.01(s,1H), 7.8, 7.7(m,1H), 7.45(m,2H), 7.35(m,4H),
7.25(m,2H), 5.25(m,1H), 3.88, 3.74(s,3H), 3.45, 3.39(s,3H),
1.62-1.56(m,3H)
- 53 δ 8.04(s,1H), 7.81(m,1H), 7.45(m,2H), 7.38-7.18(m,5H),
5.18(s,2H), 3.86(s,3H), 3.42(s,3H), 2.38(s,3H)

A-F bandymų rezultatai pateikti 1 lentelėje. Įvertinimas 100 lentelėje rodo 100 % ligos nustatymą ir įvertinimas 0 rodo, kad ligos nenustatyta (atitinkamai tirtam kiekiui).

1lentelė

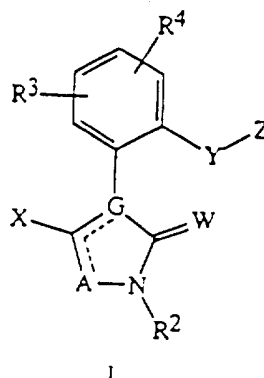
<u>Jungi-</u> <u>nys Nr.</u>	<u>A ban-</u> <u>dymas</u>	<u>B ban-</u> <u>dymas</u>	<u>C ban-</u> <u>dymas</u>	<u>D ban-</u> <u>dymas</u>	<u>E ban-</u> <u>dymas</u>	<u>F ban-</u> <u>dymas</u>
1	57	79	0	0	17	68
2	86	93	0	0	100	0
3	57	79	0	61	100	68
4	0	0	0	0	100	0
5	99	100	0	46	100	43
6	98	100	36	85	100	42
7	73	9	0	33	5	3
8	0	0	0	0	35	46
9	0	0	0	0	35	0
10	35	3	0	43	78	0
11	100	100	0	64	100	50
12	95	97	0	47	92	71
13	98	100	0	0	69*	63
14	78	81	0	0	0	0
15	100	100	0	63	100	36
16	92	57	0	0	0	0
17*	78	91	0	0	36	44

18	52	0	0	0	0	0
19	0	0	0	0	0	62
20	63	84	0	26	99	65
21	-	-	0	-	-	-
22	38	100	0	47	100	47
23	38	89	0	0	100	0
24	0	98	97	47	100	70
25	0	84	88	16	100	0
26	72	100	0	73	100	44
27	72	93	0	16	100	2
28	83	97	19	59	100	0
29	16	97	0	25	8	0
30	95	96	0	47	100	47
31	89	99	0	46	100	0
32	60	53	0	0	100	47
33	95	98	0	77	100	0
34	90	100	88	64	100	0
35	0	97	0	0	99	9
36	63	93	62	46	100	0
37	98	100	93	63	100	48
38	0	99	73	26	100	0
39	32	85	73	0	45	0
40	59	97	93	0	76	49
41	97	100	0	0	100	0
42	92	100	62	64	100	68
43	97	99	50	26	97	0
44	73	100	0	47	100	69
45	94	100	0	0	100	47
46	100	100	100	93	100	0
47	96	100	0	0	100	0
48	100	100	0	47	100	0
49	100	100	88	86	100	47
50	92	100	97	77	-	45
51	100	100	100	97	-	89

* Bandyta 40 m.d.

IŠRADIMO APIBRĖŽTIS

1. Junginys, kurio bendra formulė I, ir jo agrotechniškai tinkamos druskos,



kurioje

A yra O; S; N; NR^5 ; arba CR^{14} ;

G yra C arba N; su sąlyga, kad kai G yra C, A yra O, S arba NR^5 ir dviguba fliktuojanti jungtis prijungta prie G; ir kai G yra N, A yra N arba NR^5 ir dviguba fliktuojanti jungtis yra prijungta prie A;

W yra O arba S;

X yra OR^1 ; $\text{S(O)}_m\text{R}^1$; arba halogenas;

R^1 yra C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_2 - C_6 -alkenilas; C_2 - C_6 -halogenalkenilas; C_2 - C_6 -alkinilas; C_2 - C_6 -halogenalkinilas; C_3 - C_6 -cikloalkinilas; C_2 - C_4 -alkilkarbonilas; C_2 - C_4 -alkoksikarbonilas; arba benzoilas, galimai pakeistas R^{13} ;

R^2 ir R^5 kiekvienas nepriklausomai yra H; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_2 - C_6 -alkenilas; C_2 - C_6 -halogenalkenilas; C_2 - C_6 -alkinilas; C_2 - C_6 -halogenalkinilas; C_3 - C_6 -cikloalkinilas; C_2 - C_4 -alkilkarbonilas; C_2 - C_4 -alkoksikarbonilas; arba benzoilas, galimai pakeistas R^{13} ;

R^3 ir R^4 kiekvienas nepriklausomai yra H; ciano; nitro; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_2 - C_6 -alkenilas; C_2 - C_6 -halogenalkenilas; C_2 - C_6 -alkinilas; C_2 - C_6 -halogenalkinilas; C_1 - C_6 -alkoksi; C_1 - C_6 -halogenalkoksi; C_2 - C_6 -alkeniloksi; arba C_2 - C_6 -alkiniloksi;

Y yra $-\text{O}-$; $-\text{S(O)}_n-$; $-\text{CHR}^6-\text{CHR}^6-$; $-\text{CR}^6=\text{CR}^6-$; $-\text{C}\equiv\text{C}-$; $-\text{CHR}^6\text{O}-$; $-\text{OCHR}^6-$; $-\text{CHR}^6\text{S(O)}_n-$; $-\text{S(O)}_n\text{CHR}^6-$; $-\text{CHR}^6\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{R}^7)-$; $-(\text{R}^7)\text{C}=\text{N}-\text{OCH}(\text{R}^6)-$; $-\text{C}(\text{R}^7)=\text{N}-\text{O}-$; $-\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{R}^7)-$; $-\text{CHR}^6\text{OC(=O)N}(\text{R}^{15})-$; arba tiesioginė jungtis; ir Y ryšio kryptis yra apibrėžta taip, kad dalis, atvaizduota į kairę ryšio pusę yra sujungta su fenilo žiedu ir dalis, atvaizduota į dešinę ryšio pusę yra sujungta su Z;

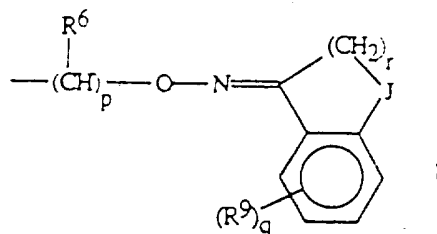
R^6 yra nepriklausomai H arba C_1 - C_3 -alkilas;

R^7 yra H; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_1 - C_6 -alkoksi; C_1 - C_6 -halogenalkoksi; C_2 - C_6 -alkenilas; C_2 - C_6 -halogenalkenilas; C_2 - C_6 -alkinilas; C_2 - C_6 -halogenalkinilas; C_3 - C_6 -cikloalkilas; C_2 - C_4 -alkilkarbonilas; C_2 - C_4 -alkoksikarbonilas; ciano; arba morfolinas;

Z yra C_1 - C_6 -alkilas, C_2 - C_{10} -alkenilas, arba C_2 - C_{10} -alkinilas, kiekvienas galimai pakeistas R^8 ; arba Z yra C_3 - C_8 -cikloalkilas arba fenilas, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^9 , R^{10} , arba abiem R^9 ir R^{10} ; arba Z yra nuo 3 iki 14-nario nearomatinio heterociklinio žiedo sistema, išrinkta iš monociklinio žiedo sistemos, kondensuoto biciklinio žiedo ir kondensuoto triciklinio žiedo, arba Z yra nuo 5 iki 14-nario aromatinio žiedo sistema, parinkta iš monociklinio žiedo, kondensuoto biciklinio žiedo ir kondensuototo triciklinio žiedo grupės, kiekvieno nearomatinio arba aromatinio žiedo sistema turi nuo 1 iki 6 heteroatomų, nepriklausomai parinktų iš grupės 1-4 azoto atomų, 1-2 deguonies atomų ir 1-2 sieros atomų, kiekviena nearomatinio arba aromatinio žiedo sistema galimai pakeista vienu iš R^9 , R^{10} arba abiem R^9 ir R^{10} ; arba

R^7 ir Z paimti kartu sudaro $CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2CH_2CH_2$, $CH_2CH_2OCH_2CH_2$, kiekviena CH_2 grupė galimai pakeista 1-2 halogeno atomais; arba

Y ir Z paimti kartu sudaro



R^3 , Y ir Z paimti kartu su fenilo žiedu sudaro naftaleno žiedą, pakeistą bet kuriame žiede nepastovioje vietoje R^4 grupę, su sąlyga, kad kai R^3 , Y ir Z paimti kartu su fenilo žiedu suformuoja naftaleno žiedą, pakeistą R^4 , ir A yra S, W yra O, X yra SCH_3 ir R^2 yra CH_3 , tada R^4 yra ne H; J yra $-CH_2-$; $-CH_2CH_2-$; $-OCH_2-$; $-CH_2O-$; $-SCH_2-$; $-CH_2S-$; $-N(R^{16})CH_2-$; arba $-CH_2N(R^{16})-$; kiekviena CH_2 grupė galimai pakeista nuo 1 iki 2 CH_3 ;

R^8 yra 1-6 halogeno atomai; C_1 - C_6 -alkoksi; C_1 - C_6 -halogenalkoksi; C_1 - C_6 -alkiltio; C_1 - C_6 -halogenalkiltio; C_1 - C_6 -alkilsulfinilas; C_1 - C_6 -alkilsulfonilas; C_3 - C_6 -cikloalkilas; C_3 - C_6 -alkeniloksi; $CO_2(C_1$ - C_6 -alkilas); $NH(C_1$ - C_6 -alkilas); $N(C_1$ - C_6 -alkilas) $_2$; ciano arba nitro; arba R^8 yra fenilas, fenoksi, piridinilas,

piridiniloksi, tienilas, furanilas, pirimidinilas, arba
 pirimidiniloksi, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^{11} , R^{12} , arba
 abiem R^{11} ir R^{12} ;

R^9 yra 1-2 halogeno atomai; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_1 - C_6 -
 alkoksi; C_1 - C_6 -halogenalkoksi; C_2 - C_6 -alkenilas; C_2 - C_6 -
 halogenalkenilas; C_2 - C_6 -alkinilas; C_1 - C_6 -alkiltio; C_1 - C_6 -halogenalkiltio;
 C_1 - C_6 -alkilsulfinilas; C_1 - C_6 -alkilsulfonilas; C_3 - C_6 -cikloalkilas; C_3 - C_6 -
 alkeniloksi; $CO_2(C_1$ - C_6 -alkilas); $NH(C_1$ - C_6 -alkilas); $N(C_1$ - C_6 -alkilas) $_2$;
 $-C(R^{18})=NOR^{17}$; ciano arba nitro; arba R^9 yra fenilas, benzilas,
 benzoilas, fenoksi, piridinilas, piridiniloksi, tienilas, tieniloksi, furanilas,
 pirimidinilas, arba pirimidiniloksi, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš
 R^{11} , R^{12} , arba abiem R^{11} ir R^{12} ;

R^{10} yra halogenas; C_1 - C_4 -alkilas; C_1 - C_4 -halogenalkilas; C_1 - C_4 -alkoksi; nitro;
 arba ciano; arba

R^9 ir R^{10} , kai prijungtas gretimas atomas, yra paimti kartu kaip $-OCH_2O-$
 arba $-OCH_2CH_2O-$; kiekviena CH_2 grupė galimai pakeista 1-2
 halogeno atomais;

R^{11} ir R^{12} kiekvienas nepriklausomai yra halogenas; C_1 - C_4 -alkilas; C_1 - C_4 -
 halogenalkilas; C_1 - C_4 -alkoksi; C_1 - C_4 -halogenalkoksi; nitro; arba ciano;

R^{13} yra halogenas; C_1 - C_3 -alkilas; C_1 - C_3 -halogenalkilas; C_1 - C_3 -alkoksi; C_1 - C_3 -
 halogenalkoksi; nitro; arba ciano;

R^{14} yra H; halogenas; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_2 - C_6 -
 alkenilas; C_2 - C_6 -halogenalkenilas; C_2 - C_6 -alkinilas; C_2 - C_6 -
 halogenalkinilas; arba C_3 - C_6 -cikloalkinilas;

R^{15} , R^{16} , R^{17} ir R^{18} kiekvienas nepriklausomai yra H; C_1 - C_3 - alkilas; arba
 fenilas, galimai pakeistas halogenu, C_1 - C_4 -alkilas; C_1 - C_4 -
 halogenalkilas; C_1 - C_4 -alkoksi; C_1 - C_4 -halogenalkoksi, nitro arba ciano;
 m, n ir q kiekvienas nepriklausomai yra 0, 1 arba 2; ir
 p ir r kiekvienas nepriklausomai yra 0 arba 1;

su sąlyga

(a) kai A yra N, G yra N, X yra $S(O)_mR^1$ ir m yra 0, tada darinys Y ir Z yra ne
 alkilas, halogenalkilas arba alkoksi; ir

(b) kai A yra NR^5 , G yra C, X yra OR^1 ir R^1 yra alkilkarbonilas,
 alkoksikarbonilas arba galimai pakeistas benzoilas, tada darinys Y ir Z yra nealkilas
 arba alkoksi.

2. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

W yra O;

R^1 yra alkilas arba halogenalkilas;

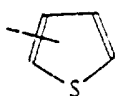
R^2 yra H; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; arba C_3 - C_6 -cikloalkilas;

R^3 ir R^4 kiekvienas nepriklausomai yra H; halogenas; ciano; nitro; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_1 - C_6 -alkoksi; arba C_1 - C_6 -halogenalkoksi;

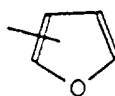
Y yra $-O-$; $-\text{CH}=\text{CH}-$; $-\text{CH}_2\text{O}-$; $-\text{OCH}_2-$; $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_n-$; $-\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{R}^7)-$; $-\text{C}(\text{R}^7)=\text{N}-\text{O}-$; $-\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{NH}-$; arba tiesioginis ryšys;

R^7 yra H; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_2 - C_6 -alkenilas; C_1 - C_6 -alkinilas; arba ciano;

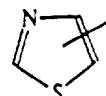
Z yra C_1 - C_6 -alkilas, galimai pakeistas R^8 ; arba C_3 - C_8 -cikloalkilas arba fenilas, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^9 , R^{10} arba abiem R^9 ir R^{10} ; arba Z yra



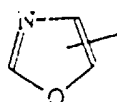
Z-1



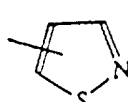
Z-2



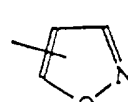
Z-3



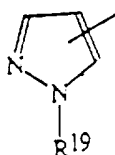
Z-4



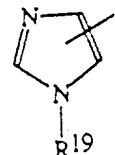
Z-5



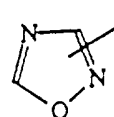
Z-6



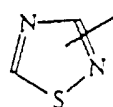
Z-7



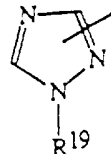
Z-8



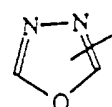
Z-9



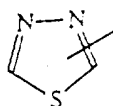
Z-10



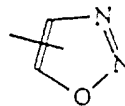
Z-11



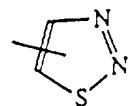
Z-12



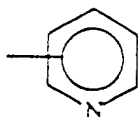
Z-13



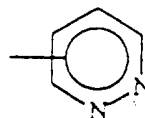
Z-14



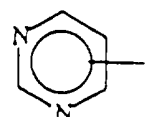
Z-15



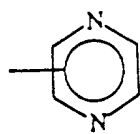
Z-16



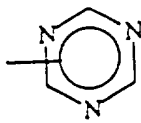
Z-17



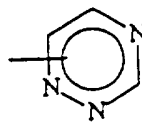
Z-18



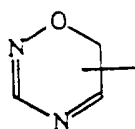
Z-19



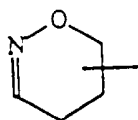
Z-20



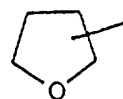
Z-21



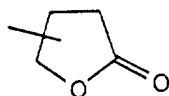
Z-22



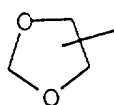
Z-23



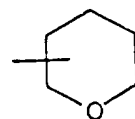
Z-24



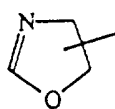
Z-25



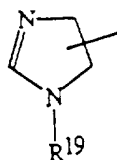
Z-26



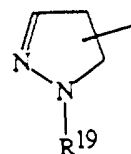
Z-27



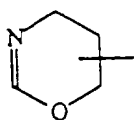
Z-28



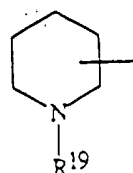
Z-29



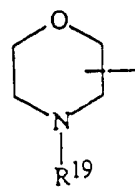
Z-30



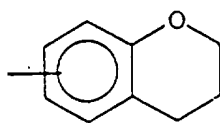
Z-31



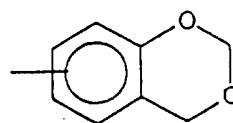
Z-32



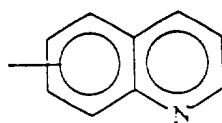
Z-33



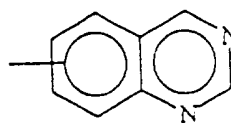
Z-34



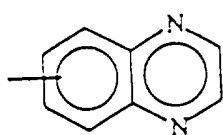
Z-35



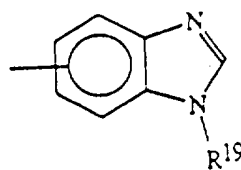
Z-36



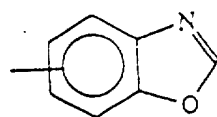
Z-37



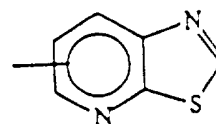
Z-38



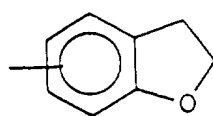
Z-39



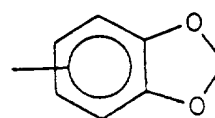
Z-40



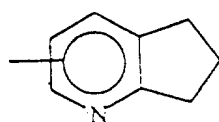
Z-41



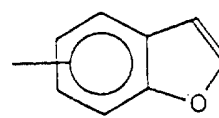
Z-42



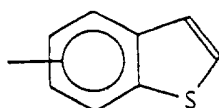
Z-43



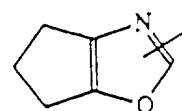
Z-44



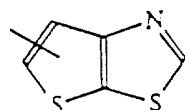
Z-45



Z-46

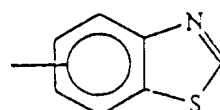


Z-47



Z-48

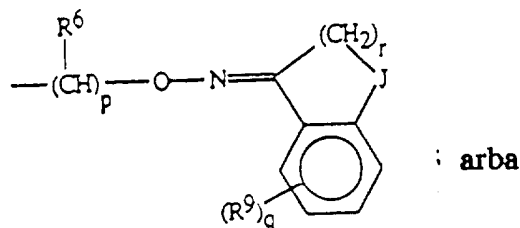
or



Z-49

kiekviena grupė galimai pakeista vienu iš R^9 , R^{10} arba
abiem R^9 ir R^{10} ; arba

R^3 , Y ir Z paimti kartu su fenilo žiedu sudaro naftaleno žiedą, pakeistą bet
kuriame iš dviejų žiedų nepastovioje vietoje R^4 grupe; arba
Y ir Z paimti kartu suformuoja



R^8 yra 1-6 halogeno atomai; C_1 - C_6 -alkoksi; C_1 - C_6 -halogenalkoksi;
arba R^8 yra fenilas, fenoksi, piridinilas, piridiniloksi, pirimidinilas, arba
pirimidiniloksi, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^{11} , R^{12} arba
abiem R^{11} ir R^{12} ;

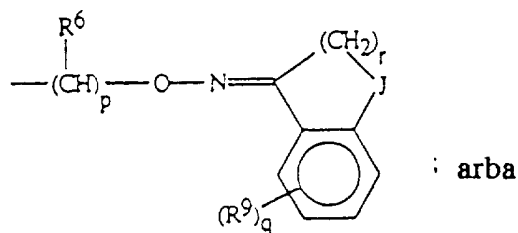
R^9 yra 1-2 halogeno atomai; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; C_1 - C_6 -
alkoksi; C_1 - C_6 -halogenalkoksi; C_1 - C_6 -alkiltio; ciano; $CO_2(C_1$ - C_6 -
alkilas); $NH(C_1$ - C_6 -alkilas); arba $N(C_1$ - C_6 -alkilas) $_2$; arba R^9 yra
 C_3 - C_6 -cikloalkilas, fenilas, fenoksi, piridinilas, piridiniloksi,
pirimidinilas, arba pirimidiniloksi, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš
 R^{11} , R^{12} arba abiem R^{11} ir R^{12} ; ir

R^{19} yra H; C_1 - C_6 -alkilas; C_1 - C_6 -halogenalkilas; arba fenilas, galimai
pakeistas halogenu, C_1 - C_4 -alkilu, C_1 - C_4 -halogenalkilu, C_1 - C_4 -alkoksilu,
 C_1 - C_4 -halogenalkoksilu, nitro arba ciano.

3. Junginys pagal 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

Z yra fenilas arba nuo Z-1 iki Z-21, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^9 ,
 R^{10} arba abiem R^9 ir R^{10} ; arba

Y ir Z paimti kartu suformuoja



J yra $-CH_2-$ arba $-CH_2CH_2-$;

p yra O; ir

r yra 1.

4. Junginys pagal 3 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

A yra O; N; NR^5 ; arba CR^{14} ;

X yra OR^1 ;

R^1 yra C_1 - C_3 -alkilas;

R^2 yra H arba C_1 - C_2 -alkilas;

R^3 ir R^4 kiekvienas yra H;

Y yra $-O-$; $-CH=CH-$; $-CH_2O-$; $-OCH_2-$; $-CH_2O-N=C(R^7)-$;
arba $-CH_2OC(=O)NH-$;

R^7 yra H; C_1-C_3 -alkilas; arba R^1 C_1-C_3 -halogenalkilas; ir

Z yra fenilas, piridinilas, pirimidinilas, arba tienilas, kiekvienas galimai pakeistas vienu iš R^9 , R^{10} , arba abiem R^9 ir R^{10} .

5. Junginys pagal 4 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

A yra O arba NR^5 ;

G yra C;

Y yra $-O-$; $-CH_2O-$; $-OCH_2-$; arba $-CH_2O-N=C(R^7)-$; ir

R^7 yra H; C_1-C_2 -alkilas; arba R^1 C_1-C_2 -halogenalkilas.

6. Junginys pagal 4 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

A yra N arba CR^{14} ;

G yra N;

Y yra $-O-$; $-CH_2O-$; $-OCH_2-$; arba $-CH_2O-N=C(R^7)-$;

R^7 yra H; C_1-C_2 -alkilas; arba R^1 C_1-C_2 -halogenalkilas.

7. Junginys pagal 5 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

R^1 yra metilas;

R^7 yra metilas; ir

Z yra fenilas, galimai pakeistas vienu iš R^9 , R^{10} , arba abiem R^9 ir R^{10} .

8. Junginys pagal 6 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

R^1 yra metilas;

R^7 yra metilas; ir

Z yra fenilas, galimai pakeistas vienu iš R^9 , R^{10} , arba abiem R^9 ir R^{10} .

9. Fungicidinė kompozicija, turinti bent vieną (a) paviršiaus aktyvią medžiagą, (b) organinį tirpiklį ir (c) bent vieną kietą arba skystą skiediklį, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad turi efektyvų kiekį junginio pagal 1 punktą.

10. Augalų apsaugos nuo ligų, sukeltų grybelinių augalų patogenų, pažidžiančių augalus, jų dalis arba augalų sėklas arba daigus būdas, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad augalus jų dalis arba augalų sėklas arba daigus paveikia efektyviu junginio pagal 1 punktą kiekiu.