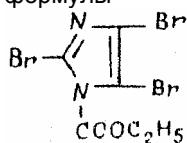


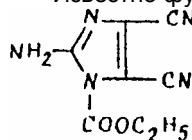
Изобретение относится к соединениям имидазола.

Известно фунгицидное средство, использующее в качестве действующего начала соединения формулы



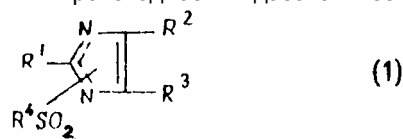
Однако оно недостаточно эффективно.

Известно фунгицидное средство на основе соединения формулы



Однако оно также недостаточно эффективно при низких концентрациях. Заявленные соединения имидазола обладают усиленной фунгицидной активностью.

Производное имидазола имеет общую формулу



где R¹ означает CN или CSNHR⁵,

R⁵ - водород, ацетил, или пропионил,

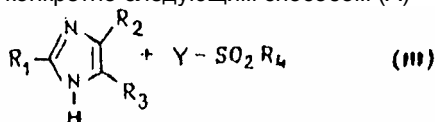
R² - водород, циклопропил, циклогексил, 2-нафтил, алкил C1-C8, C12, 3-фторпропил, 3-хлорпропил, 4-хлорбутил, 5-хлорпентил, гидроксиметил, гидроксипропил, гидроксипропил, метоксиметил, этоксиметил, фенотил, 1,2-дифенилэтил, 2,2,2-трифторэтил, 2,2,2-трифторэтокси, бензил, L-гидроксibenзил, метилбензил, 2-фторбензил, аллил, 2-бутенил, фенил, хлорфенил, фторфенил, 4-бромфенил, 2,3-дихлорфенил, 3,4-дихлорфенил, 4-метилфенил, 3-метилфенил, 2-метилфенил, 4-этилфенил, 4-изопропилфенил, 4-трет-бутилфенил, 3,4-диметилфенил, 4-метоксифенил, 4-этоксифенил, 4-метил-3-хлорфенил, 4-метокси-3-хлорфенил, 3-метил-4-метоксифенил, 3,4-метилendiоксифенил, 4-(2',2',2'-трифторэтокси)фенил, 4-цианфенил, 4-нитрофенил, 2-фурил, 5-метил-2-фурил, 2-тиенил, 5-хлор-2-тиенил, 5-бром-2-тиенил, SOnR⁶,

R⁶-алкил, C1-C4, аллил, фенил, бензил, 3-трифторметил-2-пиридил, 4-хлорфенил при n = 0, R⁶ - диметиламино, этил при n = 2; CONHR⁷, R⁷ - фенил, 4-хлорфенил;

R³ - водород, хлор, бром, йод, циано, нитро, метил, этил, метилтио, фенилтио, 2-фурил, трифторацетил;

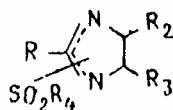
R⁴ - изопропил, диметиламино, диэтиламино, морфолино, в количестве 5 - 20мас.ч., носитель - 60 - 93мас.ч., поверхностно-активное вещество 2 - 20мас.ч.

Новое имидазоловое вещество, представленное общей формулой (1), описанной выше, может быть получено конкретным следующим способом (A)



от 10 до 150° C

от 1 до 48 часов

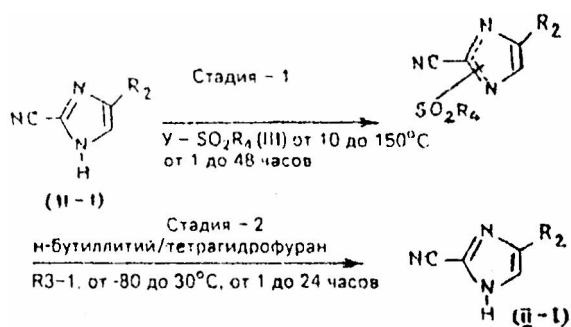


....(II) + Y - SO₂R₄ (III) от 10 до 150° C

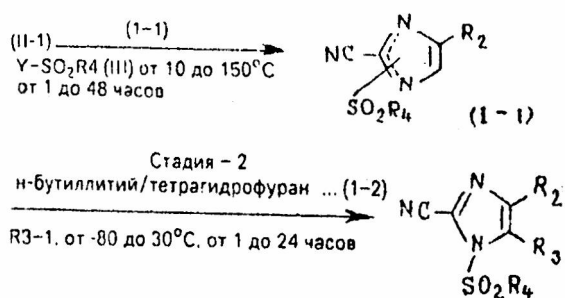
от 1 до 48 часов (1)

в которых радикалы R¹, R², R³ и R⁴ имеют те же самые значения, которые указаны выше, а Y является атомом галогена.

В описанной выше общей формуле (1), вещества, в которых R¹ является цианогруппой, также могут быть получены следующим способом: (B)



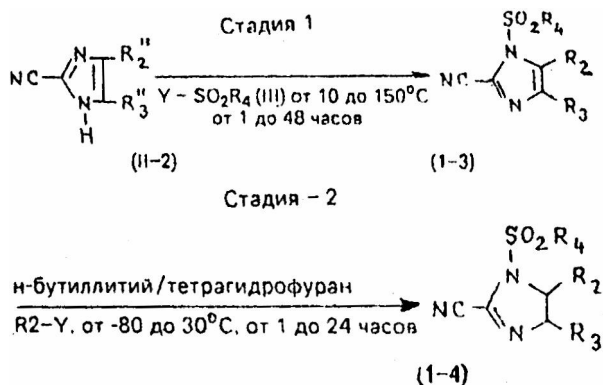
... Стадия - 1



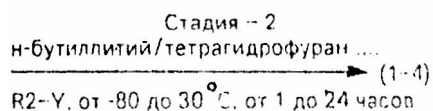
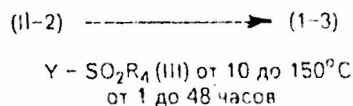
В общей формуле (1 - 2), описанной выше, в которой R3 является группой - SR7, на стадии - 2 способа (B), описанного выше, вместо R3 - 1 также можно использовать группу R7SSR7.

В приведенных выше формулах радикалы R2, R3, R4, R7 и Y имеют те же самые значения, которые описаны выше.

В описанной выше общей формуле (1), вещества, в которых R1 является цианогруппой и R3 представляет собой атом водорода, атом хлора или атом брома, также могут быть получены следующим способом: (C)

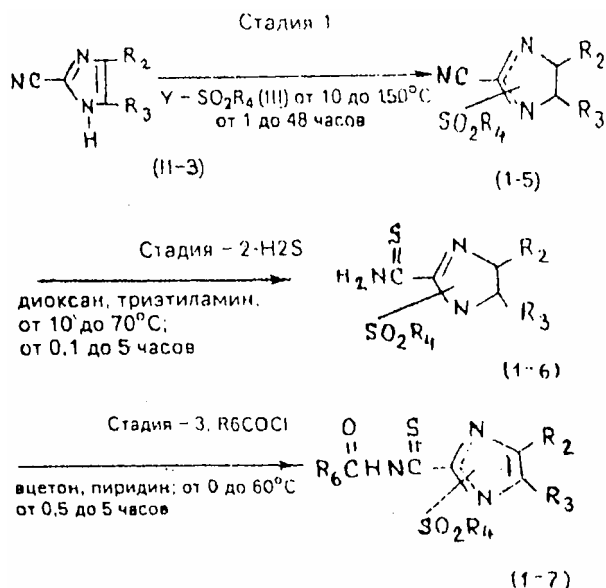


.... Стадия - 1



В общей формуле (1 - 4), описанной выше, в которой R2 является группой - SR7, на стадии - 2 способа (C) также может использоваться R7SSR7 вместо R2 - Y; и если R2 является группой -CH(OH)-R13 (в которой R13 является алкильной группой или необязательно замещенной фенильной группой). На Стадии-2 описанного выше способа (C) вместо R2 - Y', также может использоваться R13-CHO. В предшествующих формулах радикалы R2, R4 и R7 имеют те же самые значения, которые описаны выше; R2" и R3" представляют собой одновременно атомы водорода, атомы хлора или брома; Y является атомом хлора, брома или йода.

В описанной выше общей формуле (1), вещества, в которых R1 является группой -CSNH2 или группой -CSNHOR6, также могут быть получены следующим способом: (D)



где радикалы R₂, R₃, R₄, R₆ и Y имеют указанные выше значения.

Способ (A) и Стадия - 1 способов (B) - (D), описанных выше, проводятся, если это необходимо и желательно, в присутствии растворителя и акцептора кислоты.

Примеры растворителя включают ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол, хлорбензол, и др.; циклические или ациклические алифатические углеводороды, такие как хлороформ, четыреххлористый углерод, хлористый метилен, дихлорэтан, трихлорэтан, н-гексан, циклогексан и др.; простые эфиры; такие как диэтиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран и др.; кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон и др.; нитрилы, такие как ацетонитрил, пропионитрил и др.; и апротонные полярные растворители, такие как диметилформамид, N-метилпирролидон, диметилсульфоксид, сульфолан и другие.

В качестве акцептора кислоты может использоваться любое из неорганических и органических оснований. Примеры неорганического основания включают гидроксиды щелочных металлов, такие как гидроксид натрия, гидроксид калия и др.; карбонаты щелочных или щелочноземельных металлов, такие как безводный карбонат калия, безводный карбонат кальция и др.; гидриды щелочных металлов, такие как гидрид натрия; щелочные металлы, такие как металлический натрий и другие, кроме того, в качестве органического основания может быть упомянут триэтиламин и другие.

Описанная выше реакция может быть осуществлена в присутствии подходящего катализатора. В качестве катализатора может быть упомянут, например, катализатор фазового переноса, такой как производная четвертичного аммония.

В качестве атома галогена, показанного как Y в общей формуле(III), описанной выше, могут быть упомянуты атом хлора, брома, йода и атом фтора, из которых предпочтительным является атом хлора.

Пример синтеза 1

Синтез 2-циано-1-диметилсульфамоил-5-фенилтиоимидазола (соединение №45 - 6).

В четырехгорлую колбу загружают 12,0г 2-циано-1-диметилсульфамоилимидазола (Compound №1) и 240мл осушенного тетрагидрофурана в потоке азота. Поддерживая температуру смеси при -75°C или ниже смесью сухого льда с ацетоном, к смеси постепенно, по каплям добавляют 41,3мл раствора н-бутиллития в гексане (1,6 молярный) производство фирмы "Альдрих". После завершения капельного добавления, систему выдерживают в течение 15 минут при той же температуре. Затем при -70°C или ниже к смеси по каплям добавляют раствор 17г дифенилдисульфида в 30мл тетрагидрофурана. При перемешивании в течение ночи температуру смеси постепенно повышают до комнатной.

После завершения взаимодействия, реакционную смесь выливают в воду. Проводят экстракцию 500мл этилацетата. После промывания водой экстракт сушат над безводным сульфатом натрия. Этилацетат удаляют путем перегонки, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель; хлористый метилен), получая 4,3г 2-циано-1-диметилсульфамоил-5-фенилтиоимидазола (соединение №45-б), имеющего температуру плавления от 106 до 107°C.

Пример синтеза 2.

Синтез 4-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-н-пропилимидазола (соединение №48-б).

(1). 2-Циано-1-диметилсульфамоил-5-н-пропилимидазол (4,8г), имеющий температуру плавления от 51 до 52°C (соединение №43-б), синтезируют путем взаимодействия 12,0г 2-циано-1-диметилсульфамоилимидазола и 15,3г н-пропилиодида по способу, который аналогичен описанному выше в примере синтеза 1.

(2). 2-Циано-1-диметилсульфамоил-5-н-пропилимидазол (4,8г), такой как получен выше в (1), 40мл пиридина и 11,4г хлористого пиридиния смешивают, и смесь перемешивают 4 часа при 90°C. После завершения взаимодействия пиридин удаляют из реакционной смеси путем перегонки, и остаток экстрагируют этилацетатом. Экстракт промывают водой и затем сушат над безводным сульфатом натрия. После этого этилацетат удаляют путем перегонки, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель: смесь этилацетата и н-гексана) и при выделении получают

2,46г 2-циано-4(5)-н-пропилимидазола (промежуточное соединение), имеющее температуру плавления от 52 до 54°C.

(3). 2-Циано-4(5)-н-пропилимидазол, такой как получен выше в (2), 80мл хлороформа и 2,6г N-хлорсукцинимид смешивают, и смесь подвергают взаимодействию в течение 4 часов при температуре кипения с обратным холодильником. После завершения взаимодействия к реакционной смеси добавляют 200мл воды. Образовавшийся органический слой промывают водой и затем сушат над безводным сульфатом натрия. После сушки хлороформ удаляют путем перегонки, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - смесь 1 : 1 этилацетата и н-гексана), и при выделении получают 2,2г 4(5-хлор)2-циано-5(4)-н-пропилимидазола (промежуточное соединение), имеющего температуру плавления от 107 до 109°C.

(4). 4(5)-Хлор-2-циано-5(4)-н-пропилимидазол (2,0г) такой, как получен выше в (3), 30мл ацетонитрила, 1,95г безводного карбоната калия и 1,86г хлористого диметилсульфамоила смешивают и после постепенного повышения температуры, смесь подвергают взаимодействию при температуре кипения с обратным холодильником в течение 1 часа. После завершения взаимодействий ацетонитрил удаляют путем отгонки из реакционной смеси. После вливания 100мл воды к остатку, образовавшуюся смесь экстрагируют 50мл хлористого метилена. Экстракт промывают водой и сушат над безводным сульфатом натрия. После этого хлористый метилен удаляют путем перегонки. Остатку дают отстояться в течение ночи, после чего анализ смеси показал, что один из двух изомеров в смеси разложился и превратился в исходный 4(5)-хлор-2-циано-5(4)-н-пропилимидазол. Остаток, содержащий другой изомер, очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель: хлористый метилен) и при выделении получают 1,1г 4-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-н-пропилимидазола (соединение №48-б), имеющего температуру плавления от 64 до 66°C.

Пример синтеза 3.

Синтез 2-циано-1-диметилсульфамоил-4(5)-фенилимидазола (соединение №1).

(1). В 320мл ацетона растворяют 23,04г 4(5)-фенилимидазола и к раствору добавляют 12,14г безводного карбоната калия. Смесь нагревают при температуре кипения с обратным холодильником в течение 2 часов. После охлаждения к смеси по каплям добавляют 45мл ацетонового раствора, содержащего 25,26г хлористого диметилсульфамоила. После завершения капельного добавления, смесь нагревают при температуре кипения с обратным холодильником в течение 4,5 часов, чтобы реакция завершилась.

После завершения взаимодействия, реакционную смесь охлаждают, и твердые вещества удаляют путем фильтрации. После удаления растворителя путем отгонки при пониженном давлении остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель, хлористый метилен), получая 27,8г 1-диметилсульфамоил-4(5)-фенилимидазола, имеющего температуру плавления от 96 до 100°C.

(2). В 290мл тетрагидрофурана растворяют 17г 1-диметилсульфамоил-4(5)-фенилимидазола, такого как получен выше в (1).

Этот раствор охлаждают до -70°C в токе азота, и к смеси в течение 30 минут по каплям добавляют 51мл 1,6 молярного раствора н-бутиллития в гексане. После завершения капельного добавления реакционную смесь перемешивают при -70°C в течение 30 минут. Затем к смеси добавляют по каплям 12мл тетрагидрофуранового раствора, содержащего 6г N,N-диметилформамида. После завершения капельного добавления реакционную смесь подвергают взаимодействию в течение 15 часов при перемешивании, в то время как ее температура медленно повышается до комнатной.

После завершения взаимодействия реакционную смесь выливают в воду со льдом и экстрагируют этилацетатом. После промывания экстрагированного слоя водой, этот слой сушат над безводным сульфатом натрия. Отгоняют растворитель при пониженном давлении, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - смесь 1 : 2 этилацетат: н-гексан), получая 12,8г 1-диметилсульфамоил-2-формил-4(5)фенилимидазола, имеющего температуру плавления от 86 до 89°C.

(3). В 120мл пиридина растворяют 11,16г 1-диметилсульфамоил-2-формил-4(5)-фенилимидазола, такого как получен выше в (2), и 5,56г хлористоводородного гидросиламина, и 24мл уксусного ангидрида добавляют по каплям к раствору при комнатной температуре. После завершения капельного добавления температуру смеси постепенно повышают, и смесь реагирует при 100°C в течение 12 часов.

После завершения взаимодействия растворитель из реакционной смеси удаляют путем перегонки при пониженном давлении. Затем к остатку добавляют 125мл воды, и выпавшее в осадок твердое вещество отделяют путем фильтрации. Неочищенный продукт растворяют в этилацетате и очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель: этилацетат), получая 5,55г 2-циано-4(5)-фенилимидазола, имеющего температуру плавления от 208 до 205°C.

(4). В 88мл ацетона растворяют 1,7г 2-циано-4(5)-фенилимидазола, такого как получен выше в (3), и к раствору добавляют 1,7г безводного карбоната калия. Смесь нагревают при температуре кипения с обратным холодильником в течение 2 часов.

После охлаждения к смеси по каплям добавляют 6мл ацетонового раствора, содержащего 1,7г хлористого диметилсульфамоила. После завершения капельного добавления смесь нагревают при температуре кипения с обратным холодильником 2 часа, для завершения реакции.

После завершения взаимодействия реакционную смесь охлаждают, и твердое вещество удаляют путем фильтрации. После удаления растворителя путем перегонки при пониженном давлении, остаток экстрагируют этилацетатом. Экстракт промывают водой и сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель удаляют путем перегонки при пониженном давлении и получают 2г 2-циано-1-диметилсульфамоил-4(5)-фенилимидазола (соединение №1), имеющего температуру плавления от 101 до 102°C.

Пример синтеза 4.

Синтез 4(5)-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5(4)-фенилимидазола (соединение №7) и 4-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-фенилимидазола (соединение №7-б).

(1). В 100мл хлороформа растворяют 1,352г 2-циано-4(5)-фенилимидазола и к раствору добавляют 1,175г П-хлорсукцинимид. Эта смесь взаимодействует при нагревании до температуры кипения с обратным холодильником, в течение 4 часов.

После завершения взаимодействия реакционную смесь выливают в воду и экстрагируют хлороформом. После промывания водой экстрагированный слой сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель отгоняют при пониженном давлении, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель: хлористый метилен), получая 1,28г 4(5)-хлор-2-циано-5(4)-фенилимидазола (промежуточное соединение №15), имеющего температуру плавления от 149 до 151°C.

(2). В 6мл ацетона растворяют 0,43г 4(5)-хлор-2-циано-5(4)-фенилимидазола, который получен выше в (1), и к раствору добавляют 0,29г безводного карбоната калия и 0,36г хлористого диметилсульфамоила. Эта смесь взаимодействует при нагревании до температуры кипения с обратным холодильником в течение 30 минут.

После завершения взаимодействия реакционную смесь выливают в воду и экстрагируют этилацетатом. После промывания водой экстрагированный слой сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель отгоняют при пониженном давлении, и остаток затем очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель: хлористый метилен), получая 0,5г 4(5)-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5(4)-фенилимидазола (соединение №7), имеющее температуру плавления от 106 до 109°C.

В результате анализа с помощью спектров ЯМР, описанное выше соединение является смесью изомеров 4-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-фенилимидазола и 5-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-4-фенилимидазола в почти равных отношениях.

(3). После выдерживания в течение 24 часов при комнатной температуре 2,9г смеси этих изомеров, которая получена способом, аналогичным описанному выше в (2), ее очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель: хлористый метилен), получая 1,15г 4-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-фенилимидазола (соединение №7-о), имеющего температуру плавления от 109 до 112°C. Кроме того, посредством очистки и выделения из этого соединения было также получено 0,7г 4(5)-хлор-2-циано-5(4)-фенилимидазола (промежуточное соединение).

Пример синтеза 5.

Синтез 4(5)-хлор-2-циано-1-диметил-сульфамоил-5(4)-(4)-метилфенил) имидазола (соединение №8) и 4-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-(4-метилфенил)имидазола (соединение №8-б).

Смесь изомеров (соединение №8), имеющая температуру плавления от 101 до 108°C, 4-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-(4-метилфенил)имидазол и 5-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-4-(4-метилфенил)-имидазол, была получена из 4(5)-(4-метилфенил)имидазола в соотношении 6 : 4 способом, аналогичным примерам синтезов 4, и 5, которые описаны выше. После того как 0,75г смеси изомеров прореагируют при 40°C в течение 8 часов, реакционную смесь очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель: хлористый метилен), получая 0,45г 4-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-(4-метилфенил)имидазола (соединение №8-б), имеющего температуру плавления от 133 до 134°C. Кроме того, путем очистки и выделения из этого соединения также получают 0,15г 4(5)-хлор-2-циано-5(4)-(4-метилфенил)имидазола, имеющего температуру плавления от 124 до 129°C.

Пример синтеза 6.

Синтез 4(5)-хлор-5(4)-(4-хлорфенил)-2-циано-1-диметилсульфамоилимидазола (соединение №12), 4-хлор-5-(4-хлорфенил)-2-циано-1-диметилсульфамоилимидазола (соединение №12-б) и 5-хлор-4-(4-хлорфенил)-2-циано-1-диметилсульфамоилимидазола (соединение №12-а).

Способом, который аналогичен примерам синтезов 4 и 5, описанным выше, 0,80г изомерной смеси (соединение №12), имеющей температуру плавления около 108°C, 4-хлор-5-(4-хлорфенил)-2-циано-1-диметилсульфамоилимидазола и 5-хлор-4-(4-хлорфенил)-2-циано-1-диметилсульфамоилимидазола, получают из 4(5)-(4-хлорфенил)-имидазола. Смесь изомеров очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель: хлористый метилен). Элюат второй фракции концентрируют и подвергают перекристаллизации из хлористого метилена, получая 0,16г 4-хлор-5-(4-хлорфенил)-2-циано-1-диметилсульфамоилимидазола (соединение №12-б), имеющего температуру плавления от 117 до 120°C. Кроме того, элюат первой фракции концентрируют таким же образом, получая 0,50г 5-хлор-4-(4-хлорфенил)-2-циано-1-диметилсульфамоилимидазола (соединение №12-а), имеющего температуру плавления от 133 до 138°C.

Пример синтеза 7.

Синтез 1-диметилсульфамоил-4(5)-фенилимидазола-2-карботиоамида (соединение №23).

В 30мл диоксана растворяют 1,0г 2-циано-1-диметилсульфамоил-4(5)-фенилимидазола (соединение №1), и к раствору добавляют 0,36г триэтиламина. Смесь нагревают до температуры от 40 до 50°C при перемешивании, и вводят в нее газообразный сероводород в течение 1 часа и 25 минут. После этого смесь реагирует при 40-50°C еще в течение 50 минут.

После завершения взаимодействия реакционную смесь охлаждают, выливают в воду и экстрагируют этилацетатом. После промывания водой экстрагированный слой сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель отгоняют при пониженном давлении, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - смесь 1 : 3 этилацетата и н-гексана), получая 0,8г 1-диметилсульфамоил-4(5)-фенилимидазол-2-карботиоамида (соединение №23), имеющего температуру плавления от 155 до 175°C. Кроме того, в небольшом количестве получают кристаллы 4(5)-фенилимидазол-2-карботиоамида.

Пример синтеза 8.

Синтез 2-циано-1-изопропилсульфонил-4(5)-фенилимидазол (соединение №32).

При комнатной температуре смешивают 1г 2-циано-4(5)-фенилимидазола, 0,98г безводного карбоната калия и 30мл ацетонитрила. После взаимодействия в течение 2 часов при температуре кипения реакционную смесь охлаждают, и раствор 1,0г хлористого изопропилсульфонил в 5мл ацетонитрила добавляют к смеси. Эта смесь снова реагирует при температуре кипения в течение 1,5 часов.

После завершения реакции, реакционную смесь выливают в воду. Проводят экстракцию хлористым метиленом. После промывания водой экстракт сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель удаляют путем перегонки при пониженном давлении, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель: хлористый метилен), получая 1,4г 2-циано-1-изопропилсульфонил-4(5)-фенилимидазола (соединение №32), имеющего температуру плавления от 80 до 83°C.

Пример синтеза 9. Синтез 4(5)-(2-тиенил)-2-циано-1-диметилсульфамоиимидазола (соединение №3).

(1). К 150мл формамида добавляют 25г 2-(бромацетил)тиофена. Смесь подвергают взаимодействию при 180 - 190°C в течение 2 часов.

После завершения взаимодействия реакционную смесь выливают в воду и добавляют в нее концентрированную соляную кислоту, для того, чтобы сделать систему кислотной. Затем проводят промывание хлористым метиленом. После нейтрализации аммиачной водой, водную фазу экстрагируют хлористым метиленом. После промывания водой экстракт сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель удаляют путем перегонки при пониженном давлении, получая 11г 4(5)-(2-тиенил)-имидазола.

(2). К 200мл ацетонитрила добавляют 11,6г хлористого диметилсульфамоиола, 11,1г безводного карбоната калия и 11г 4(5)-(2-тиенил)имидазола, который получен выше в (1). При перемешивании эта смесь реагирует в течение 2 часов.

После завершения взаимодействия реакционную смесь выливают в воду. Проводят экстракцию этилацетатом. После промывания водой экстракт сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель удаляют путем перегонки при пониженном давлении, получая 14,5г 4(5)-(2-тиенил)-1-диметилсульфамоиола.

(3). В 120мл безводного тетрагидрофурана растворяют 9,5г 4(5)-(2-тиенил)-1-диметилсульфамоиимидазола, который получен выше в (2). В токе азота при -78°C к раствору по каплям добавляют 26,2мл 1,6 молярного раствора н-бутиллития в гексане, и смесь перемешивают при той же температуре в течение 15 минут. Затем к смеси по каплям добавляют 20мл тетрагидрофура нового раствора, в котором растворено 5,4г N,N-диметилформамида. После завершения капельного добавления, температуру смеси постепенно повышают до комнатной, для того, чтобы реакция завершилась.

После завершения взаимодействия, реакционную смесь выливают в воду. Проводят экстракцию этилацетатом. После промывания водой экстракт сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель удаляют путем перегонки при пониженном давлении, получая 5,4 г 4(5)-(2-тиенил)-2-формил-1-диметилсульфамоиимидазола.

(4). В 54мл пиридина растворяют 2,6г хлористоводородного гидроксилamina и 5,4г 4(5)-(2-тиенил)-2-формил-1-диметилсульфамоиимидазола, который получен выше в (3). Раствор перемешивают при комнатной температуре в течение 15 минут. Затем к раствору постепенно добавляют 10мл уксусного ангидрида, после чего осуществляют реакцию при 60 - 70°C в течение 2 часов.

После завершения взаимодействия, реакционную смесь выливают в воду. Проводят экстракцию этилацетатом. После промывания водой экстракт сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель удаляют путем перегонки при пониженном давлении и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - смесь 2 : 1 этилацетата и н-гексана), получая 1,2г 4(5)-(2-тиенил)-2-цианоимидазола, имеющего температуру плавления от 195 до 203°C.

(5). К 50мл ацетонитрила добавляют 1,1г хлористого диметилсульфамоиола, 1,0г безводного карбоната калия и 1,2г 4(5)-(2-тиенил)-2-цианоимидазола, который получен выше в (4). Эта смесь взаимодействует при температуре кипения в течение 2 часов.

После завершения взаимодействия реакционную смесь выливают в воду и экстрагируют этилацетатом. После высушивания экстракта над безводным сульфатом натрия, растворитель удаляют путем перегонки при пониженном давлении, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - хлористый метилен), получая 1,3г 4(5)-(2-тиенил)-2-циано-1-диметилсульфамоиимидазола (соединение №3), имеющего температуру плавления от 145 до 150°C.

Пример синтеза 10.

Синтез 4(5)-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоиола-5(4)-изопропилимидазола (соединение №125) и 4-хлор-2-циано-11-диметилсульфамоиола-5-изопропилимидазола (соединение №86-б).

(1). Нагревают до 180°C 360г формамида и добавляют к нему по каплям в течение 30 минут 102г 1-гидрокси-3-метил-2-бутанола (приготовленного по способу, описанному Липшутцом и Морей в J. Org. Chem., том 48, 3745 (1983)). После завершения капельного добавления смесь реагирует при 180°C в течение 1 часа.

После завершения взаимодействия реакционную смесь охлаждают и выливают в ледяную воду. Образовавшуюся смесь подкисляют до pH между 4 и 5 аммиачной водой. К нему добавляют 5г активированного древесного угля, и смесь перемешивают в течение 1 часа. Активированный древесный уголь удаляют путем фильтрации, и фильтрат подщелачивают до pH 8 аммиачной водой. Затем проводят экстракцию хлористым метиленом, и экстракт сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель удаляют путем перегонки при пониженном давлении, получая 13г 4(5)-изопропилимидазола.

(2). В 300мл ацетонитрила растворяют 11,8г 4(5)-изопропилимидазола, который получен выше в (1), и к раствору добавляют 18г безводного карбоната калия. Смесь кипятят с обратным холодильником в

течение 30 минут, и после охлаждения к ней по каплям добавляют 17г хлористого диметилсульфамоила. После завершения капельного добавления смесь кипятят, чтобы реакция завершилась.

После завершения взаимодействия реакционную смесь охлаждают, выливают в воду и затем экстрагируют этилацетатом. Экстрагированный слой промывают водой и сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель удаляют путем перегонки при пониженном давлении, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель: хлористый метилен), получая 13г 1-диметилсульфамоил-4(5)-изопропилимидазола.

(3). В 200мл тетрагидрофурана растворяют 13г 1-диметилсульфамоил-4(5)-изопропилимидазола, который получен выше в (2). Этот раствор охлаждают до -70°C в токе азота и добавляют к нему по каплям в течение 15 минут 38мл 1,6 молярного раствора н-бутиллития в гексане. После завершения капельного добавления смесь перемешивают при -70°C в течение 30 минут. После капельного добавления 5,6г N,N-диметилформамида, смесь реагирует при перемешивании в течение 15 минут, в то время как ее температура медленно повышается до комнатной.

После завершения взаимодействия реакционную смесь выливают в ледяную воду и экстрагируют этилацетатом. Экстрагированный слой промывают водой и сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель отгоняют при пониженном давлении, получая 8,6г 1-диметилсульфамоил-2-формил-4(5)-изопропилимидазола.

(4). В 100мл пиридина растворяют 8,5г 1-диметилсульфамоил-2-формил-4(5)-изопропилимидазола, который получен выше в (3), и 4,8г хлористоводородного гидроксилamina, и к этому раствору по каплям добавляют 10мл уксусного ангидрида при комнатной температуре. После завершения капельного добавления, температуру смеси постепенно повышают, и смесь реагирует 5 часов при температуре от 80 до 90°C.

После завершения взаимодействия из реакционной смеси отгоняют растворитель при пониженном давлении. К остатку добавляют воду, и смесь экстрагируют этилацетатом. Экстрагированный слой промывают разбавленной соляной кислотой и затем водой, и сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель отгоняют при пониженном давлении, получая 2,35г 2-циано-4(5)-изопропилимидазола (промежуточное соединение), имеющее температуру плавления от 88 до 91°C.

(5). В 80мл метанола растворяют 2г 2-циано-4(5)-изопропилимидазола, который получен выше в (4), и к раствору добавляют 2,1г П-хлорсукцинимид. Смесь перемешивают при комнатной температуре в течение 20 часов и затем подвергают взаимодействию при 40°C в течение 8 часов.

После завершения взаимодействия, из реакционной смеси при пониженном давлении отгоняют метанол. К остатку добавляют воду, и смесь экстрагируют этилацетатом. Экстрагированный слой промывают водой над безводным сульфатом натрия. Растворитель отгоняют при пониженном давлении, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель: хлористый метилен), получая 1,67г 4(5)-хлорциано-5(4)-изопропилимидазола, имеющего температуру плавления от 84 до 87°C.

(6). В 30мл ацетонитрила растворяют 1,6г 4(5)-хлор-2-циано-5(4)-изопропилимидазола, который получен выше в (5), и к раствору добавляют 1,56г безводного карбоната калия. Смесь кипятят с обратным холодильником в течение 30 минут. После охлаждения в нее добавляют 1,49г диметилсульфамоилхлорида, по каплям. После завершения капельного добавления смесь кипятят в течение 15 минут, чтобы взаимодействие завершилось.

После окончания взаимодействия реакционную смесь охлаждают, выливают в воду и затем экстрагируют этилацетатом. Экстрагированный слой промывают водой и сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель отгоняют при пониженном давлении, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - хлористый метилен), получая 2,1г 4(5)-хлор-2-циано-1-сульфамоил-5(4)-изопропилимидазола (соединение №86)*.

В результате анализа с помощью спектров ЯМР установлено, что описанное выше соединение является смесью изомеров 4-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-изопропилимидазола и 5-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-4-изопропилимидазола в примерном соотношении 2 : 1.

(7). После выдерживания в течение 5 суток при комнатной температуре, 2,1г смеси изомеров, полученной выше в (6), подвергают хроматографической очистке на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - хлористый метилен), получая 1г 4-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-изопропилимидазола (соединение №86-б), имеющего температуру плавления от 75 до 82°C (разлагается). Кроме того, путем очистки и выделения из этого соединения также получают 4(5)-хлор-2-циано-5(4)-изопропилимидазол.

Пример синтеза 11.

Синтез 4-хлор-1-диметилсульфамоил-5-н-пропилимидазол-2-карботиоамида (соединение №129-б).

(1). В четырехгорлую колбу загружают 6,0г 2-циано-4,5-дихлор-1-диметилсульфамоилимидазола, имеющего температуру плавления от 100 до 103°C и 180мл осушенного тетрагидрофура на в токе азота. Поддерживая температуру смеси при -75°C или ниже (с помощью смеси сухой лед/ацетон к смеси постепенно, по каплям добавляют 15,3мл 1,6 молярного раствора н-бутиллития в гексане (производство фирмы Альдрих). После завершения капельного добавления систему выдерживают при этой температуре в течение 15 минут. Затем к смеси при -70°C или ниже по каплям добавляют раствор 5,7г н-пропилиодида в 15мл тетрагидрофурана. При перемешивании в течение ночи температура смеси постепенно повышается до комнатной.

После завершения взаимодействия реакционную смесь выливают в воду. Проводят экстракцию хлористым метиленом (500мл). После промывания водой экстракт сушат над безводным сульфатом натрия. Хлористый метилен удаляют путем перегонки, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - хлористый метилен) и затем снова очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - смесь этилацетата и н-

гексана), получая 2,8г 4-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-н-пропилимидазола (соединение №48-б), имеющего температуру плавления от 66 до 68°C.

(2). В четырехгорлую колбу загружают 2,7г 4-хлор-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-н-пропилимидазола, который получен выше в (1), 40мл диоксана, 1,0г триэтиламина и 0,8г пиридина. В эту смесь вводят газообразный сероводород при температуре от 20 до 25°C, приблизительно в течение 30 минут, до тех пор пока не прореагируют исходные материалы.

После завершения взаимодействия реакционную смесь выливают в воду, а выпавшие в осадок кристаллы отфильтровывают на фильтре Нутча и сушат. Образовавшиеся кристаллы очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - хлористый метилен) и выделяют, получая 2,3г 4-хлор-1-диметилсульфамоил-5-н-пропилимидазола (соединение №129-б), имеющего температуру плавления от 160 до 162°C.

Пример синтеза 12.

Синтез N-пропионил-4-хлор-1-диметилсульфамоил-5-н-пропилимидазола-2-карботиоамида (соединение №121-б).

В четырехгорлую колбу загружают 2,0г 4-хлор-1-диметилсульфамоил-5-н-пропилимидазола-2-карботиоамида (соединение №121-в), 24мл ацетона и 1,12г пиридина. К смеси при температуре от 0 до 5°C по каплям добавляют 1,19г хлористого пропионила. После завершения капельного добавления взаимодействие осуществляют при 30 - 35°C в течение 1 часа и при температуре кипения с обратным холодильником еще в течение 30 минут, при перемешивании.

После завершения взаимодействия, реакционную смесь выливают в воду и экстрагируют этилацетатом. Экстрагированный слой промывают водой и сушат над безводным сульфатом натрия. После этого этилацетат удаляют при перегонке, а остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - хлористый метилен), и выделяют, получая 1,02г N-пропионил-4-хлор-1-диметилсульфамоил-5-н-пропилимидазола-2-карботиоамида (соединение №121-б), имеющего температуру плавления от 130 до 152°C.

Пример синтеза 13.

Синтез 2-циано-1-диметилсульфамоил-4,5-дифенилтиоимидазол (соединение №38).

(1). 2-Циано-1-диметилсульфамоил-5-фенилтиоимидазол (8,0г, соединение №45-б), полученный так же, как и в примере синтеза №1, описанном выше, 60мл метанола и 60мл 7% - ной соляной кислоты загружают в колбу, смесь подвергают взаимодействию при перемешивании, при 40 - 50°C в течение 2 часов. После завершения взаимодействия реакционную смесь слегка подщелачивают аммиаком, и осажденные кристаллы отделяют путем фильтрации и сушат, получая 4,2г 2-циано-4(5)-фенилтиоимидазола, имеющего температуру плавления от 166 до 169°C.

(2). К смеси 4,2г 2-циано-4(5)-фенилтиоимидазола, полученного выше в (1), 80мл ацетонитрила и 3,1г безводного карбоната калия добавляют 3,4г хлористого диметилсульфамоила. Образовавшуюся смесь подвергают взаимодействию при температуре кипения с обратным холодильником в течение 1 часа. После завершения взаимодействия реакционную смесь охлаждают, и твердые вещества отфильтровывают. Растворитель из фильтрата удаляют путем перегонки, а остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - хлористый метилен) и выделяют, получая 5,8г 2-циано-1-диметилсульфамоил-4(5)-фенилтиоимидазола.

(3). В четырехгорлую колбу загружают 5,8г 2-циано-1-диметилсульфамоил-4(5)-фенилтиоимидазола, который получен выше в (2), и 150мл осушенного тетрагидрофурана в атмосфере азота, и к этой смеси по каплям добавляют 12,9мл 1,6-молярного раствора н-бутиллития в гексане (производство фирмы Канте Кагаку), причем температуру смеси поддерживают при -75°C или ниже (с помощью смеси сухой лед/ацетон). После завершения капельного добавления смесь выдерживают при той же температуре в течение 15 минут, и по каплям добавляют к смеси при -70°C или ниже 20мл раствора 3,2г дифенилсульфида в тетрагидрофуране. После этого смеси дают нагреться до комнатной температуры. По окончании взаимодействия реакционную смесь экстрагируют этилацетатом. Экстракт промывают водой и сушат над безводным сульфатом натрия. Растворитель удаляют путем перегонки, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - хлористый метилен) и выделяют, получая 1,7г 2-циано-1-диметилсульфамоил-4(5)-дифенилтиоимидазола (соединение №38), имеющего температуру плавления от 98 до 101°C.

Пример синтеза 14.

Синтез 4-бром-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-н-пропилимидазола (соединение №109-б).

(1). 2-Циано-4,5-дибром-1-диметилсульфамоилимидазол, имеющий температуру плавления от 118 до 120°C, синтезируют из 2-циано-4,5-дибромимидазола, имеющего температуру плавления от 200 до 203°C.

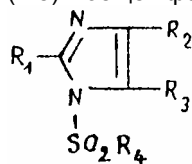
(2). В четырехгорлую колбу емкостью 200мл, загружают 5г 2-циано-4,5-дибром-1-диметилсульфамоилимидазола, который получен выше в (1), и 120мл осушенного тетрагидрофурана в токе азота. Поддерживая температуру смеси при -75°C или ниже (смесью сухой лед/ацетон), в нее постепенно, по каплям добавляют 9,6мл 1,6 молярного раствора н-бутиллития в гексане (производство фирмы Альдрих). После окончания капельного добавления систему выдерживают при той же температуре в течение 15 минут. Затем к смеси по каплям добавляют раствор 3,6г йодистого н-пропила в 15мл тетрагидрофурана при температуре -75°C или ниже. При перемешивании смеси дают постепенно нагреться до комнатной температуры.

После завершения взаимодействия реакционную смесь экстрагируют этилацетатом. После промывания водой экстракт сушат над безводным сульфатом натрия. Этилацетат удаляют путем перегонки, и остаток очищают хроматографически на колонке с силикагелем (проявляющий растворитель - хлористый метилен), получая 2,1г 4-бром-2-циано-1-диметилсульфамоил-5-н-пропилимидазола (соединение №109-б), имеющего температуру плавления от 93 до 94°C.

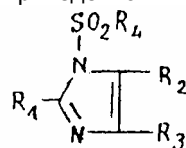
Типичные примеры имидазодовых веществ (общая формула (1) настоящего изобретения приведены в

табл.1.

Среди имидазодовых соединений настоящего изобретения приведенных в табл.1, соединения в номерах которых имеется индекс "а" охватываются общей формулой (1-а) в общей формуле (1), приведенной выше, а соединения, в номерах которых имеется индекс "б", охватываются общей формулой (1-б) в общей формуле (1), приведенной выше.



(I-a)



(I-б)

Дополнительные характеристики соединений:

соединение 18 Н-ЯМР (ацетон): 2,87 (С) м.д., 3,27 (С) м.д. 7,4 - 8,2 (м, 4Н) м.д.

Данные элементного анализа:

Найдено, %: С 36,4; Н 2,8; П 13,9

Вычислено, %: С 37,0; Н 2,6; П 14,4

соединение 65-6 Н-ЯМР (CDC13): 2,0 - 2,3 (м, 2Н) м.д. 2,7 - 3,3 (м, 8Н) м.д., 3,5 - 3,8 (т, 2Н) м.д., 6,97 (0,1 Н) м.д.

Ниже описываются примеры испытаний фунгицидных композиций, предназначенных для уничтожения вредных микроорганизмов на сельскохозяйственных и садоводческих площадях в соответствии с настоящим изобретением.

Стандарты оценки сельскохозяйственных и садоводческих фунгицидов удовлетворяют следующим критериям оценки, если не оговорено особо.

Стандарты оценки

Эффект контроля определяют визуальным наблюдением степени заболевания испытуемого растения и выражали в соответствии со следующими 5 группами индексов контроля.

(Индекс контроля) (Степень заболевания)

5: Поражение не наблюдается.

4: Площадь, число и длительность поражения составляет менее 10% по сравнению с необработанным участком.

3: Площадь, число или длина поражений составляет менее 40% по сравнению с необработанным участком.

2: Площадь, число или длина поражений составляет менее 70% по сравнению с необработанным участком.

1: Площадь, число или длина поражений составляет менее 70% по сравнению с необработанным участком.

Испытательный пример 1.

Испытание на превентивное действие против настоящей мучнистой росы огурцов.

Огурцы (культиватор: Сайс) культивируют в полиэтиленовой чаше диаметром 7,5см. По достижению огурцами стадии одного листа, огуречные растения опрыскивают с помощью распылителя 10мл раствора, полученного растворением препаративных форм по примерам 1-6, 8, 9 каждого из испытуемых соединений до определенной концентрации. После выдерживания чаш в температурной камере при 22 - 24°C в течение одного дня и одной ночи, проводят инокуляцию конидиумом грибка настоящей мучнистой росы (*Sphaerotheca guliginea*). Через десять дней после инокуляции исследуют площадь поражения первого листка и в соответствии со стандартами оценки приведенными выше, определяли индекс контроля. Полученные результаты представлены в табл.2.

Аналогичные результаты получены, когда используют любой из примеров получения форм.

Испытательный пример 2.

Испытание на превентивный эффект против антракноза огурцов.

Огурцы (разновидность: Сайо) культивируют в полиэтиленовой чаше диаметром 7,5см. После достижения огурцами стадии двух листьев огурцы опрыскивают из распылителя 10мл раствора каждого из испытуемых соединений взятых в определенной концентрации, полученного из препаративных форм. После выдерживания чаш в температурной камере при 22 - 24°C в течение одного дня и одной ночи, проводят инокуляцию суспензией спор грибка антракноза (*Colletotrichum lagenarium*). Через семь дней после инокуляции исследуют площадь поражения первого листка и в соответствии со стандартами оценки, приведенными выше, определяют индекс контроля. Полученные, результаты представлены в табл.3.

Испытательный пример 3.

Испытание на превентивное действие против ложной мучнистой росы огурцов.

Огурцы (разновидность: Сайо) культивируют в полиэтиленовой чаше диаметром 7,5см. После достижения огурцами стадии двух листьев, огурцы опрыскивают 10мл раствора каждого из испытуемых соединений взятых в определенной концентрации. После выдерживания чаш в термостате при 22 - 24°C в течение одного дня и одной ночи, проводят инокуляцию суспензией спор грибка ложной мучнистой росы (*Pseudoperonospora eubensis*). Через шесть дней после инокуляции площадь первого листка и в соответствии со стандартами оценки, приведенными выше, определяют индекс контроля. Полученные результаты представлены в табл.4.

Испытательный пример 4.

Испытание на целебный эффект против ложной мучнистой росы огурцов.

Огурцы (культуратор: Сайо) культивируют в полиэтиленовой чаше диаметром 7,5см. После достижения стадии двух листьев, огурцы инокулируют суспензией спор грибка ложной мучнистой росы (*Pseudoperonospora eubensis*). Через шесть часов после инокуляции огурцы опрыскивают с помощью распылителя 10мл раствора каждого из испытуемых соединений взятых в определенной концентрации. После выдерживания чаш в термостате при 22 - 24°C в течение 6 дней, исследуют площадь поражения первого листка и в соответствии со стандартами оценки приведенными выше, определяют индекс контроля. Полученные результаты представлены в табл.5.

Испытательный пример 5.

Испытание на системную активность против ложной мучнистой росы огурцов.

Огурцы (разновидность: Сайо) культивируют в полиэтиленовой чаше диаметром 7,5см. После достижения огурцами двулистной стадии поверхность почвы с помощью пипетки смачивают 15мл раствора каждого из испытуемых соединений взятых в определенной концентрации. После выдерживания чаш в термостате при 22 - 24°C в течение 2 дней, проводят инокуляцию суспензией спор грибка ложной мучнистой росы (*Pseudoperonospora eubensis*). Через шесть дней после инокуляции исследуют площадь поражения первого листка, и в соответствии с описанными выше стандартами оценки, определяют индекс контроля. Полученные результаты представлены в табл.6.

Испытательный пример 6.

Испытание на превентивный эффект против ранней гнили помидор.

Помидоры (разновидность: Подероза) культивируют в полиэтиленовой чаше диаметром 7,5см. После достижения помидорами стадии четырехлистника, их опрыскивают с помощью распылителя 10мл раствора каждого из испытуемых соединений взятых в определенной концентрации. После выдерживания чаш в камере с постоянной температурой при 22 - 24°C в течение одного дня и одной ночи, проводят инокуляцию суспензией зооспорангия грибка ранней гнили (*Phytophthora infestans*). Через пять дней после инокуляции исследуют площадь поражения листьев и, в соответствии со стандартами оценки приведенными выше, определяют индекс контроля.

Полученные результаты представлены в табл.7.

Испытательный пример 7.

Испытание на системную активность против ранней гнили помидор.

Помидоры (разновидность: Подероза) культивируют в полиэтиленовой чаше диаметром 7,5см. После достижения помидорами стадии четырехлистника, поверхность почвы, с помощью пипетки, смачивают 15мл раствора каждого из испытуемых соединений взятых в определенной концентрации. После выдерживания чаш в камере с постоянной температурой при 22 - 24°C, в течение 2 дней, проводят инокуляцию суспензией зооспорангия грибка ранней гнили (*Phytophthora infestans*). Через пять дней после инокуляции исследуют площадь поражения листьев и, в соответствии со стандартами оценки приведенными выше, определяют индекс контроля. Полученные результаты представлены в табл.8.

Испытательный пример 8.

Испытание на превентивный эффект против пирикулярриоза риса.

Рисовые растения (производитель: Чукио Асахи) культивируют в полиэтиленовой чаше диаметром 7,5см. После достижения рисовыми растениями стадии четырехлистника, их опрыскивают из распылителя 20мл раствора каждого из испытуемых соединений взятых в определенной концентрации. После выдерживания чаш в камере с постоянной температурой при 22 - 24°C в течение одного дня и одной ночи, проводят инокуляцию суспензией спор грибка пирикулярриоза (*Pyricularia oryzae*). Через пять дней после инокуляции исследуют степень поражения и в соответствии со стандартами оценки приведенными выше, определяют индекс контроля. Полученные результаты представлены в табл.9.

Испытательный пример 9.

Испытание на превентивный эффект против пирикулярриоза риса.

Рисовые растения (производитель: Чукио Асахи) культивируют в полиэтиленовой чаше диаметром 7,5см. После достижения рисовыми растениями стадии пятилистника, их с помощью распылителя опрыскивают 20мл раствора каждого из испытуемых соединений взятых в определенной концентрации. После выдерживания чаш в камере с постоянной температурой при 22 - 24°C в течение одного дня и одной ночи, между частями листового влагалища, с целью инокуляции, помещают рисовую соломку, в которой предварительно инкубируют грибок гнили оболочки (*Rhizoctonia solani*). После выдерживания чаш в инокуляционной камере при температуре 28°C и влажности 100% в течение 5 дней, исследуют длину поражения и, в соответствии со стандартами оценки приведенными выше, определяют индекс контроля. Полученные результаты представлены в табл.10.

Испытательный пример 10.

Испытание на превентивный эффект против корончатой ржавчины овса.

Овес (производитель: Зеншин) культивируют в полиэтиленовой чаше диаметром 7,5см. После достижения рисовыми растениями стадии двухлистника, их с помощью распылителя опрыскивают 10мл раствора каждого из испытуемых соединений взятых в определенной концентрации. После выдерживания чаш в камере с постоянной температурой при 22 - 24°C в течение одного дня и одной ночи, проводят инокуляцию конидия грибов корончатой ржавчины. Через десять дней после инокуляции исследуют площадь поражения второго листка и, в соответствии со стандартами оценки приведенными выше, определяют индекс контроля. Полученные результаты представлены в табл.11.

Испытательный пример 11.

Испытание на превентивный эффект против килы репы.

Почву загрязненную грибом килы крестоцветник (*Plasmodiophora brassicae*) помещают в чашу площадью 1/14,000 ара (1/140м²) и поверхность почвы, с помощью пипетки, смачивают 20мл раствора каждого из испытуемых соединений с концентрацией активного ингредиента 4кг/10ар и 1кг/10ар. Через день после обработки проводят перемешивание слоев почвы и высевают репу (производитель: Канамаша).

Кокабу). Репу выращивают в теплице. Через 30 дней после посева исследуют степень поражения килой, и в соответствии со стандартами оценки, приведенными ниже, определяют индекс контроля. Полученные результаты представлены в табл.12.

Стандарты оценки		
(Индекс контроля)	(Степень проявления поражения килой)	
5:	образование килы:	нет
4:	" :	небольшое
3:	" :	среднее
2:	" :	значительное
1:	" :	обильное

Испытательный пример 12.

Антимикробное испытание (фитопатогенный грибок).

Мицелиальные диски (проштампованные агаром) предварительно инкубированного *Pythium arhanoihermatum* трансплантируют на картофельно-декстрозную агаровую среду (среда РДА), содержащую 100ч/млн стрептомицина и 100ч/млн каждого из испытуемых соединений. После инкубирования в течение 48 часов при 22°С измеряют диаметр мицелия. Ингибирование гифального роста (%) определяют по следующему уравнению. Полученные результаты представлены в табл.13.

Ингибирование гифального роста (%) –

$$-100 \frac{\text{диаметр мицелия в обработанной чаше}}{\text{диаметр мицелия в необработанной чаше}} \times 100$$

Ниже приведены рецептурные примеры настоящего изобретения, однако соединения, доза в рецептуре, тип рецептур и т.п. настоящего изобретения не ограничиваются значениями указанными ниже.

Рецептурный пример 1 (смачиваемый порошок).

Соединение №7-б 20вес.ч.

Каолин 72 "

Лигнин сульфат натрия 4

Алкиларилловый эфир

полиоксиэтилена 4 "

Указанные компоненты подвергают однородному перемешиванию.

Рецептурный пример 2 (смачиваемый порошок).

Соединение №8-б 6вес.ч.

Диатомовая земля 88 "

Диалкилсульфосукцинат 2 "

Полиоксиэтилен алкиларил

сульфат 4

Указанные компоненты подвергали равномерному смешиванию.

Рецептурный пример 3 (смачиваемый порошок).

Каолин 78вес.ч.

Конденсат бета-нафталин

сульфоната натрия и

формальдегида 2

Полиоксиэтилен алкиларил

сульфат 5

Мелкозернистая смесь кремния 15 "

80в.ч. указанных компонентов и 206г соединения 11 перемешивают.

Рецептурный пример 4 (смачиваемый порошок).

Соединение №48-б 10вес.ч.

Диатомовая земля 69

Порошок карбоната кальция 15

Диалкилсульфосукцинат 1 "

Полиоксиэтилен

алкиларилсульфат 3

Конденсат бета-нафталин

сульфоната натрия и

формальдегида 2

Указанные компоненты подвергали равномерному перемешиванию.

Рецептурный пример 5 (смачиваемый порошок).

Соединение №48-б 10вес.ч.

Диатомовая земля 69 "

Порошок карбоната кальция 15 "

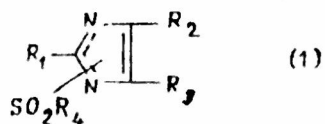
Диалкилсульфосукцинат 1 "

Полиоксиэтилен 3 "

алкиларилсульфат	
Конденсат бета-нафталинсульфоната натрия и формальдегида	2
Указанные компоненты подвергали равномерному перемешиванию.	
Рецептурный пример 6 (смачиваемый порошок).	
Соединение №7-б	20вес.ч.
Каолин	62,4 "
Мелкозернистая смесь кремния	12,8 "
Алкиларилсульфонат	1,6 "
Полиоксиэтилен	
алкиларилсульфат	2,4
Полиоксиэтилен алкилариловый эфир	0,8 "
Указанные компоненты подвергали равномерному перемешиванию.	
Рецептурный пример 7 (эмульгируемый концентрат).	
Соединение №14	20вес.ч.
Ксилол	60 "
Полиоксиэтилен алкилариловый эфир	20
Указанные компоненты подвергали равномерному перемешиванию.	
Рецептурный пример 8 (эмульгируемый концентрат).	
Соединение №98-б	10вес.ч.
Ксилол	70 "
Полиоксиэтилен алкилариловый эфир	20
Указанные компоненты подвергали равномерному перемешиванию.	
Рецептурный пример 9 (суспензионный концентрат).	
Соединение №39	10вес.ч.
Кукурузное масло	77 "
Полиоксиэтилен касторовое масло	12 "
Комплекс бентонита с алкиламином	1 "
Указанные выше компоненты равномерно смешивают и измельчают в порошок.	
Рецептурный пример 10 (эмульгируемый концентрат).	
Активный ингредиент (соединение 7-б)	5
П-метил-2-пирролидон	5
Ксилол	70
Полиоксиэтилен	
стирилфениловый эфир	10
Алкиларилсульфонат	10
Рецептурный пример 11 (эмульгируемый концентрат).	
Активный ингредиент (соединение 7-б)	10
П-метил-2-пирролидон	8
Ксилол	62
Полиоксиметилен	
стирилфениловый эфир	10
Алкиларилсульфонат	10
Рецептурный пример 12 (эмульгируемый концентрат).	
Активный ингредиент (соединение 17-б)	20
П-метил-2-пирролидон	15
Ксилол	45
Полиоксиэтилен	
стирилфениловый эфир	10
Алкиларилсульфонат	10
Рецептурный пример 13 (суспендируемый концентрат).	
Активный ингредиент (соединение 7-б)	5
Оксиэтилированный полиарилфосфат	2
Квантовая смола (биополимер)	0,2
Магнийалюмосиликат	1
Вода	91,8
Рецептурный пример 14 (суспендируемый концентрат).	
Активный ингредиент (соединение 7-б)	10

Оксиэтилированный полиарилфосфат	2
Ксантановая смола (биополимер)	0,2
Магнийалюмосиликат	0,5
Вода	87,3
Рецептурный пример 15 (суспендируемый концентрат).	
Активный ингредиент (соединение 7-б)	20
Оксиэтилированный полиарилфосфат	2
Ксантановая смола (биополимер)	0,2
Магнийалюмосиликат	0,5
Вода	77,3
Рецептурный пример 16 (смачиваемый порошок).	
Активный ингредиент (соединение 7-б)	5
Кизельгур	40
Меловой порошок	49
Диалкилсульфосукцинат	2
Полиоксиэтилен алкиларилсульфат	4

Таблица 1



№ веще- ства	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Температу- ра плавле- ния
1	2	3	4	5	6
1	CN	Фенил	H	N(CH ₃) ₂	101-102
2	"	4-Хлорфенил	"	"	148-149
3	"	2-Тиенил	"	"	145-150
4	"	5-Хлор-2-тиенил	"	"	145-148
5	"	5-Бром-2-тиенил	"	"	138-140
6	"	4-Нитрофенил	"	"	107-108
7	"	Фенил	Cl	"	106-109
8	"	4-Метилфенил	"	"	101-108
9	"	3-Метилфенил	"	"	90-95
10	"	3,4-Диметилфенил	"	"	95-105
11	"	4-Метоксифенил	"	"	102-107
12	"	4-Хлорфенил	"	"	108
13	"	3,4-Дихлорфенил	"	"	99-105
14	"	4-Фторфенил	"	"	105-107
15	"	4-Метилфенил	Br	"	106-108
16	"	4-Трет-бутилфенил	"	"	105-110
17	"	4-Фторфенил	"	"	87-93
18	"	4-Хлорфенил	"	"	
19	"	4-Бромфенил	Cl	"	110-116
20	"	2-Нафтил	"	"	124-126
21	"	Фенил	CH ₃	"	101-105
22	"	Фенил	CN	"	124-129
23	-CSNH ₂	Фенил	H	"	155-175
24	"	4-Хлорфенил	H	"	197-201

25.	-CSNH ₂	фенил	Cl	N(CH ₃) ₂	110-120
26.	-"	H	Br	-"	140-144
27.	CN	3,4-дихлорфенил	H	-"	139-142
28.	-"	2-фторфенил	Cl	-"	96-101
29.	-"	CH ₃	NO ₂	-"	110-117
30.	-"	5-метил-2-фурил	H	-"	120-124
31.	-"	CH ₃	CN	-"	80-84
32.	-"	фенил	H	изопропил	80-82
33.	-"	фенил	Cl	-N(O ₂ H) ₂	70-80
34.	-"	фенил	Br	-"	55-76
35.	-"	фенил	Cl	морфолино	106-110
36.	-"	2-фурил	2-фурил	N(CH ₃) ₂	118-123
37.	-"	S-H-C ₄ H ₉	Cl	-"	86-88
38.	-"	фенилтио	фенилтио	-"	98-101
39.	-"	бензил	Cl	-"	94-97
40.	-"	OCH ₂ CF ₃	Br	-"	77-79
41.	-"	H	иод	-"	101-105
42.	-"	-SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	-"	142-149
43-6	-"	H-C ₃ H ₇	H	-"	51-52
44-6	-"	SOCH ₃	"	-"	114-115
45-6	-"	фенилтио	"	-"	106-107
46-6	-"	H	Cl	-"	111-114
47-6	-"	CH ₃	"	-"	90-95
48-6	-"	H-C ₃ H ₇	"	-"	64-66
7-6	-"	фенил	"	-"	109-112
8-6	-"	4-метилфенил	"	-"	123-124

49-6	CN	2-метилфенил	Cl	N(CH ₃) ₂	93-96
12-a	-"-	4-хлорфенил	"	-"-	123-128
12-6	-"-	-"-	"	-"-	117-120
50-6	-"-	2-хлорфенил	"	-"-	113-117
14-6	-"-	4-фторфенил	"	-"-	120-122
51-6	CN	SCN ₂	Cl	-N(CH ₃) ₂	101-103
52-6	-"-	фенилтио	"	-"-	107-108
53-6	-"-	H	Br	-"-	100-102
54-6	-"-	CH ₃	"	-"-	107-110
55-6	-"-	фенил	"	-"-	122-124
15-6	-"-	4-метилфенил	"	-"-	136-137
56-6	-"-	C ₂ H ₅	"	-"-	112-115

57-6	CN	-CH ₂ CH=CH ₂	"	-N(CH ₃) ₂	92-94
58-6	"	4-Изопропилфенил	Cl	"	110-114
58-6	"	"	"	"	135-138
59-a	"	Фенил	SCH ₃	"	99-101
25-6	CSNH ₂	Фенил	Cl	"	115-128
60-6	"	Фенил	B	"	110-118
61-6	CN	3-Метил-4-метоксифенил	Cl	"	115-118
62-6	"	4-Этилфенил	"	"	110-112
63-6	"	Фенилтио	Br	"	94-97
64-6	"	Бензил	"	"	87-89
65-6	"	3-Хлорфенил	H	"	
66-6	"	SO ₂ C ₂ H ₅	"	"	121-124
67-6	"	3-Фторпропил	Cl	"	75-79
68-6	"	2-Хлорфенил	B	"	119-123
69-6	CN	4-(2',2',2'-Трифторэтоксифенил	Cl	N(CH ₃) ₂	111-113
70-6	"	"	Br	"	115-118
71-6	"	-CH ₂ OH	H	"	106-107
72-6	"	3-Хлорфенил	Cl	"	96-99
73-6	"	SCH ₂ CH=CH ₂	H	"	20-30
74-6	"	1,2-Дифенилэтил	H	"	101-103
75-6	"	L-Гидроксibenзил	"	"	98-100
33-6	"	Фенил	Cl	-N(C ₂ H ₅) ₂	99-101
34-6	"	"	Br	"	
35-6	"	"	Cl	Морфолино	
76-6	"	"	Br	"	126-130
77-6	"	4-Хлорфенилтио	Cl	-N(CH ₃) ₂	92-94
78-6	"	3-Хлорпропил	"	"	102-105
79-6	"	C ₂ H ₅	"	"	95-97
80-6	"	H-C ₄ H ₉	"	"	48-49
81-6	"	H-C ₅ H ₁₁	"	"	37-39
82-6	"	H-C ₆ H ₁₃	"	"	23,5
	"				1.5002
83-6	"	H-C ₇ H ₁₅	"	"	23,5
	"				1.5019
84-6	"	H-C ₈ H ₁₇	"	"	23,6
					1.4981
85-6	"	H-C ₁₂ H ₂₅	"	"	34-36
86-6	"	изо-C ₃ H ₈	"	"	75-82

(разложен)

87-6	CN	изо-C ₄ H ₉	Cl	N(CH ₃) ₂	73-76
88-6	-"	Циклопропил	"	-"	76-79
89-6	-"	Циклогексил	"	-"	107-111
90-6	-"	-CH ₂ CH=CH ₂	"	-"	67-72
91-6	-"	SC ₂ H ₅	"	-"	107-110
92-6	-"	S-H-C ₃ H ₇	"	-"	70-74
93-6	-"	Бензилтио	"	-"	149-152
94-6	CN	3-Трифторметил-2-пиридилтио	Cl	N(CH ₃) ₂	126-127
95-6	-"	-"	H	-"	109-111
96-6	-"	4-Хлорфенилтио	"	-"	110-112
97-6	-"	Фенилтио	C ₂ H ₅	-"	86-89
98-6	-"	4-Хлорбутил	Cl	-"	22,1
					Пр 1.5382
99-6	-"	5-Хлорпентил	"	-"	24,8
					Пр 1.5328
100-6	-"	CH ₂ OCH ₃	"	-"	64-66
101-6	-"	CH ₂ OCH ₂ H ₅	"	-"	82-84
102-6	-"	1-Гидроксипропил	"	-"	70-73
106-6	-"	1-Гидоксибутил	"	-"	24,2
					Пр 1.5097
39-6	-"	Бензил	"	-"	92-100
104-6	-"	4-Метилбензил	"	-"	125-129
105-6	-"	3-Метилбензил	"	-"	93-96
106-6	-"	2-Метилбензил	"	-"	119-123
107-6	-"	2-Фторбензил	"	-"	105-109
108-6	CN	Фенетил	Cl	N(CH ₃) ₂	106-110
109-6	-"	H-C ₃ H ₇	Br	-"	93-94
110-6	-"	H-C ₄ H ₉	"	-"	
111-6	-"	H-C ₆ H ₁₃	"	-"	99-101
112-6	-"	S-H-C ₃ H ₇	"	-"	76-78
113-6	-"	S-изо-C ₄ H ₉	"	-"	77-79
114-6	-"	CH ₂ OCH ₃	"	-"	65-67
115-6	-"	CH ₂ OC ₂ H ₅	"	-"	100-101
116-6	CN	П-(4-хлорфенил)	"	N(CH ₃) ₂	106-109
		Карбамоил			
117-6	-"	П-Фенилкарбамоил	"	-"	106-107
41-а	-"	H-C ₃ H ₇	1	-"	76-79
41-б	-"	H-C ₃ H ₇	1	-"	99-103

118-а	-"	-"	-COCF3	-"	90-92
119-б	-CSNH2	-"	Cl	-"	160-162
120-б	N-Ацетилтиокар- бамоил	-"	"	-"	119-123
121-б	N-Пропиопилтио- карбамоил	-"	"	-"	150-152
122-б	N-Ацетилтиокар- бамоил	Фенил	"	-"	110-114
123-б	CN	4-Метил-3-хлорфенил	Cl	-"	99-108
124-б	-"	-"	Br	-"	103-106
125-б	CN	4-Метокси-3-хлорфенил	Cl	N(CH3)2	97-101
126-б	-"	2,3-Дихлорфенил	"	-"	103-107
127-б	-"	4-Этоксифенил	"	-"	122-124
128-б	-"	-"	Br	-"	110-113
129-б	-"	3,4-Метилendioксифенил	Cl	-"	150-153
130-б	-"	-"	Br	-"	95-98
131-б	-"	4-Цианофенил	C	-"	182-185
132-б	-"	-"	Br	-"	175-178
133-б	-"	4-Нитрофенил	Cl	-"	144-146
134-б	-"	2-Бутенил	"	-"	87-90
135-б	-"	изо-C5H11	"	-"	45-47

Таблица 2

№ соединения	Индекс контроля 500 ч/млн
47-б	4
12-а	4
65-б	4
76-б	3
92-б	4
112-б	3
113-б	3
115-б	5

Таблица 3

№ соединения	Индекс контроля 500 ч/млн
43-6	3
7-6	3
14	5
52-6	3
25	3
25-6	3
65-6	3
71-6	3
72-6	4
73-6	3
74-6	3
32	4
35	4

Таблица 4

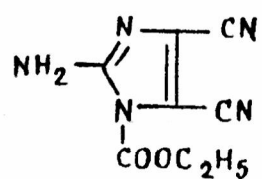
№ соединения	Индекс контроля		Соединение №	Индекс контроля	
	125 ч/млн	31 ч/млн		125 ч/млн	31 ч/млн
1	5	5	53-ь	5	5
2	5	5	54-ь	5	5
3	5	4			
4	5	5	55-ь	5	5
5	5	3	15	—	5
46-6	5	3	16	5	5
47-6	5	5	17	—	5
48-6	—	5	18	5	5
7	5	5	21	5	5
7-6	—	5			
12	5	5	22	5	5
23	5	4	32	5	4
24	5	5	33	5	5
26	5	5	35	4	—
60-6	5	5			

Таблица 5

№ соединения	Индекс контроля		Соединение №	Индекс контроля	
	125 ч/млн	31 ч/млн		125 ч/млн	31 ч/млн
1	2	3	4	5	6
43-6	5	-	5	5	-
44-6	5	-	55-6	5	-
45-6	5	-	15	5	-
6	5	-	15-6	5	-
46-6	5	-	17	5	-
47-6	5	-	18	5	-
48-6	5	-	56-6	-	5
7	5	-	57-6	-	5
7-6	5	-	19	-	5
8	-	5	59-a	5	-
8-6	5	-	22	4	-
9	5	-	25	5	-
49-6	5	-	25-6	5	-
11	5	-	26	5	-
12	5	-	60-6	5	-
12-a	5	-	62-6	5	-
12-6	5	-	63-6	-	5
50-6	-	5	64-6	-	5
13	-	4	65-6	-	5
14	-	5	66-6	-	5
14-6	5	-	67-6	-	5
51-6	5	-	68-6	5	-
52-6	5	-	69-6	5	-
53-6	5	-	70-6	-	4
54-6	5	-	71-6	4	-
72-6	5	-	96-6	-	5
28	-	5	38	4	-
29	-	4	97-6	5	5
75-6	5	-	98-6	-	5
31	-	5	99-6	-	5
32	4	-	100-6	5	5
33-6	5	-	101-6	5	5
76-6	5	-	102-6	-	5
77-6	-	5	103-6	5	-
78-6	5	5	39	-	5
79-6	5	5	39-6	5	5
80-6	5	5	104-6	-	3

81-6	5	5	105-6	-	5
82-6	5	5	106-6	-	5
86-6	-	5	107-6	-	5
87-6	-	5	108-6	-	5
88-6	-	5	109-6	-	5
89-6	-	5	111-6	5	5
90-6	5	5	40	5	3
91-6	-	5	112-6	5	5
92-6	5	4	113-6	5	5
37	5	5	114-6	5	5
93-6	4	-	115-6	5	5
94-6	-	3	116-6	4	-
41	5	-	130-6	5	-
41-a	-	5	131-6	4	-
41-6	-	5	133-6	5	5
119-6	-	5	134-6	-	5
120-6	-	5	135-6	-	5
121-6	-	5	Соед. А*	1	1
122-6	5	5	Соед. Б**	2	1
42	5	4	Ипридион	1	-
123-6	4	-			
125-6	3	-			
129-6	4	3			

А*--



Б**--

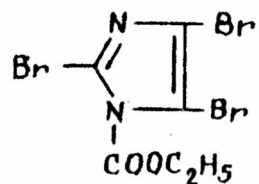


Таблица 6

№ соединения	Индекс контроля	
	500 ч/млн	125 ч/млн
46-6	5	5
47-6	—	5
7	5	4
53-6	5	5
54-6	5	5
18	5	5
26	5	5
60-6	5	5

Таблица 7

№ соединения	Индекс контроля		
	125	31	8
1	2	3	4
43-6	—	5	—
1	5	4	—
2	5	5	—
3	5	4	—
4	5	5	—
5	5	5	—
44-6	—	5	—
45-6	—	—	5
6	—	5	3
46-6	—	5	—
47-6	—	4	—
48-6	—	5	4
7	5	5	—
7-6	5	5	—
8	—	5	—
8-6	—	5	—
9	—	5	—
49-6	—	5	—
10	—	5	—
11	—	5	—
12	5	5	—
12-а	—	5	—
12-6	—	5	—
50-6	—	5	5

13	-	5	5
14	-	5	-
14-6	-	5	-
51-6	-	5	-
52-6	-	5	-
53-6	5	5	-
54-6	-	5	-
55-6	5	5	-
15	5	5	-
15-6	-	5	-
16	4	4	-
17	5	5	-
18	-	5	-
56-6	-	-	5
57-6	-	5	5
19	-	5	5
58-a	-	5	-
58-6	-	5	-
20	-	-	5
21	5	5	-
59-a	5	5	-
22	5	5	-
23	5	3	-
24	4	-	-
25	5	5	-
25-6	5	4	-
26	5	5	-
60-6	5	5	-
61-6	-	4	5
62-6	-	5	-
63-6	-	-	5
64-6	-	5	5
65-6	-	-	5
66-6	-	5	-
67-6	-	5	5
68-6	-	5	-
27	5	5	-
69-6	-	-	5

70-6	-	-	5
72-6	-	-	5
28	-	-	5
73-6	-	4	-
29	-	-	5
74-6	-	5	-
75-6	-	5	-
30	-	-	5
31	-	-	5
32	5	5	-
33	5	-	-
34	5	4	-
35	5	4	-
76-6	5	4	-
77-6	-	-	4
78-6	-	5	5
79-6	-	-	5
36	-	5	5
80-6	-	5	5
81-6	-	5	5
82-6	-	5	5
83-6	-	5	5
84-6	-	5	5
85-6	-	5	5
86-6	-	-	5
87-6	-	-	5
88-6	-	5	4
89-6	-	5	5
90-6	-	5	5
91-6	-	5	5
92-6	-	-	5
37	-	5	5
93-6	-	5	5
94-6	-	-	5
95-6	-	-	5
96-6	-	-	4
38	-	5	3
97-6	-	5	5

98-6	-	-	4
99-6	-	5	5
100-6	-	4	3
101-6	-	4	-
102-6	-	-	5
39	-	-	5
39-6	-	5	5
104-6	-	-	5
105-6	-	-	5
106-6	-	-	5
107-6	-	-	5
108-6	-	-	5
109-6	-	-	5
111-6	-	5	5
40	-	5	3
112-6	-	5	5
113-6	-	5	5
114-6	-	5	3
115-6	-	5	-
116-6	-	4	3
117-6	-	4	-
41	-	-	5
41-6	-	5	5
118-6	-	5	5
119-6	-	-	5
120-6	-	-	5
121-6	-	-	5
122-6	-	5	4
42	-	4	-
123-6	-	5	5
124-6	-	5	5
125-6	-	4	5
126-6	-	-	5
127-6	-	5	5
128-6	-	5	-
129-6	-	5	5
130-6	-	4	-
131-6	-	4	3
132-6	-	4	-
133-6	-	5	3
134-6	-	5	5
135-6	-	5	5
Соед. А	1	1	1
Соед. Б	1	1	1
Ипродион	1	-	-

Таблица 8

№ соединения	Индекс контроля	
	500 ч/млн	125 ч/млн
43-6	—	4
45-6	5	5
48-6	—	4
7-6	5	4
9	4	4
49-6	5	4
11	5	4
51-6	5	5
52-6	5	—
25	5	5
25-6	5	5
57-6	5	5
63-6	—	4
64-6	5	3
65-6	—	4
75-6	—	5

Таблица 9

№ соединения	Индекс контроля 500 ч/млн
51-6	4
22	3
60-6	3
61-6	4
37	3
112-6	3
123-6	4
124-6	4

Таблица 10

№ соединения	Индекс контроля 500 ч/млн
3	3
10	3
51-6	3
16	3
25-6	3
60-6	3
34	3

Таблица 11

№ соединения	Индекс контроля 500 ч/млн
1	3
46-6	3
26	4
65-6	3
34	4
41	5
42	3

Таблица 12

№ соединения	Индекс контроля		№ соединения	Индекс контроля	
	4 кг/10 ар.	1 кг/10 ар.		4 кг/10 ар.	1 кг/10 ар.
1	2	3	4	5	6
1	4	—	51-6	5	5
2	5	5	53-6	—	5
3	5	5	54-6	—	5
4	5	5	55-6	—	5
5	5	5	15	5	5
44-6	5	4	15-6	—	5
45-6	—	5	16	5	5
6	—	5	17	5	5
46-6	5	5	18	5	5
47-6	—	5	56-6	—	5
48-6	5	5	57-6	—	5
7	—	5	58-а	—	5
7-6	—	5	58-6	—	5
8	5	5	59-а	5	—
8-6	—	5	23	—	4
9	5	5	24	5	5
49-6	5	4	25	5	5
10	5	5	25-6	5	5
11	5	5	26	—	5
12	5	5	60-6	5	4
12-а	—	4	61-6	—	5
12-6	—	4	62-6	—	5
50-6	—	5	64-6	—	5
14	5	4	65-6	5	5
14-6	—	5	68-6	—	5

69-6	-	5	41	5	5
70-6	-	5	123-6	-	5
73-6	4	-	124-6	-	5
31	-	4	127-6	-	5
35	4	-	128-6	-	5

Т а б л и ц а 13

№ соединения	Ингибирование гифального роста (%)
43-6	100
2	95
4	100
44-6	100
45-6	100
46-6	100
47-6	100
48-6	100
7	100
7-6	100
12	100
51-6	100
52-6	100
53-6	100
54-6	100
15	100
16	100
17	100
18	100
21	100
23	100
60-6	100
32	100
33	100
34	100
35	100
41	100