

ČESkoslovenská
socialistická
republika
(19)



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

236688
(11) (B2)

(51) Int. Cl.⁸
A 01 N 47/10
C 07 C 125/06

(22) Přihlášeno 29 10 82
(21) (PV 7698-82)

(32) (31) (33) Právo přednosti od 29 10 81
(174043/1981) a od 19 01 82
(7257/1982) Japonsko

(40) Zveřejněno 17 09 84

(45) Vydáno 15 02 87

(72)
Autor vynálezu

NOGUCHI HIROSHI, TOYONAKA, KATO TOSHIRO, TAKARAZUKA,
TAKAHASHI JUNYA, NISHINOMIYA, ISHIGURI YUKIO, TAKARAZUKA,
YAMAMOTO SHIGEO, IKEDA, KAMOSHITA KATSUZO, TOYONO-GUN
(Japonsko)

(73)
Majitel patentu

SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED, OSAKA (Japonsko)

(54) Fungicidní prostředek a způsob výroby účinné složky

1

Předložený vynález se týká fungicidního prostředku, který obsahuje jako účinnou složku nové N-fenylkarbamáty. Dále se vynález týká způsobu výroby těchto fungicidů účinných N-fenylkarbamátů.

Je známo, že fungicidy benzimidazol-thiofanatového typu, jako Benomyl [methyl-1-(butylkarbamoyl)-benzimidazol-2-ylkarbamát], Fubelidazol [2-(2-furyl)benzimidazol], Thiabendazole [2-(4-thiazolyl)-benzimidazol], Carbendazim [methyl-benzimidazol-2-ylkarbamát], Thiophanate-methyl [1,2-bis-(3-methoxykarbonyl-2-thioureido)-benzon], Thiophanate [1,2-bis-(3-ethoxykarbonyl-2-thioureido)benzen], 2-(O,S-dimethylfosforylamino)-1-(3'-methoxykarbonyl-2'-thioureido)-benzen a 2-(O,O-dimethylthiofosforylamino)-1-(3'-methoxykarbonyl-2'-thioureido)-benzen vykazují vynikající fungicidní účinnost proti různým fytopatogenním houbám, a že jsou od r. 1970 v široké míře používány jako fungicidy v zemědělství. V důsledku trvalého dlouhodobého používání těchto látek se

2

však u fytopatogenních hub vytvořila resistence, čímž je značně snížen preventivní účinek těchto látek proti chorobám rostlin. Dále pak houby, u nichž se vytvořila resistence na určité druhy fungicidů benzimidazol-thiofanatového typu, rovněž vykazují značnou resistenci na jiné druhy fungicidů benzimidazol-thiofanatového typu. U těchto hub může tedy snadno vzniknout zkřížená resistance. Pokud se tedy zjistí, že se u některé látky snížuje její preventivní účinnost proti chorobám rostlin v určité oblasti, přeruší se v této oblasti její aplikace. Často je však pozorováno, že četnost výskytu organismů resistantních na určitou látku se nesnížuje ani dlouhou dobu poté, co byla ukončena aplikace této látky. I když v takovémto případě se používají fungicidy jiného typu, pouze několik málo z nich má takovou účinnost při potírání různých fytopatogenních hub, jako fungicidy benzimidazol-thiofanatového typu. Fungicidy na bázi cyklických imidů, jako jsou Procydione [3-(3',5'-dichlorfenyl)-1,2-dimethylcyklopropan-1,2-dikarboximid], Iprodione [3-(3',5'-dichlorfenyl)-1-isopropylkarbamoylimidazolidin-2,4-dion], Vinchlozoline [3-(3',5'-(dichlorfenyl)-5-methyl-5-vinyloxazolidin-2,4-dion],

ethyl-(RS)-3-(3',5'-dichlorfenyl)-5-methyl-2,4-dioxooxazolidin-5-karboxylát,

atd., které jsou účinné proti různým chorobám rostlin, zejména proti chorobám vyvolávaným organismem *Botrytis cinerea*, mají stejné nevýhody jaké byly vysvětleny výše v souvislosti s fungicidy benzimidazol-thiofanatového typu.

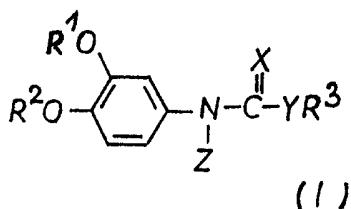
V C. R. Acad. Sc. Paris, t. 289, Série D, str. 691—693 (1979) je popsáno, že takové herbicidy jako

Barban [4-chlor-2-butinyl-N-(3-chlorfenyl)karbamát],

Chlorpropham [isopropyl-N-(3-chlorfenyl)karbamát] a

Propham [isopropyl-N-fenylkarbamát], vykazují fungicidní účinnost proti určitým organismům resistantním na některé fungicidy benzimidazol-thiofanatového typu. Fungicidní účinnost těchto sloučenin na houby resistantní není však dostatečně vysoká a proto tyto látky nelze v praxi jako fungicidy používat.

Jako výsledek studia směřujícího k hledání nového typu fungicidů bylo nyní zjištěno, že N-fenylkarbamáty obecného vzorce I



v němž

R^1 a R^2 , které mají stejný nebo vzájemně rozdílný význam, znamenají alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, allylovou skupinu, propargylovou skupinu nebo halogenalkylovou skupinu s 1 až 2 atomy uhlíku,

R^3 znamená alkylovou skupinu s 1 až 8 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 3 až 8 atomy uhlíku, alkinylovou skupinu se 3 až 8 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinu se 4 atomy uhlíku, halogenalkenylovou skupinu se 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu se 4 atomy uhlíku, fenethylovou skupinu, furylemethylovou skupinu, halogenalkylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku, kyanethylovou skupinu, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části a se 2 až 3 atomy uhlíku v alkylové části, allyloxyethylovou skupinu, halogenethoxyethylovou skupinu, methoxyhalogenalkylovou skupinu se 3 atomy uhlíku v alkylu, benzyloxyethylovou skupinu, cykloalkylalkylovou skupinu se 3 až 5 atomy uhlíku v cykloalkylové části a s 1 až 2 atomy uhlíku v alkylové části nebo tetrahydrofuranylovou skupinu,

X a Y jsou stejné nebo navzájem rozdílné a znamenají kyslík nebo síru, a

Z znamená vodík, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, allylovou skupinu, ethoxykarbonylmethylovou skupinu, alkanoylovou skupinu se 2 až 5 atomy uhlíku, cyklopropankarbonylovou skupinu, benzylovou skupinu, halogenbenzylovou skupinu, methylbenzylovou skupinu nebo methansulfonylovou skupinu, s omezením, že když R^1 znamená methylovou skupinu, pak R^2 neznamená ani methylovou skupinu ani butylovou skupinu, vykazují výtečnou fungicidní účinnost proti fytopatogenním houbám, u kterých se vytvořila resistance na fungicidy benzimidazol-thiofanatového typu nebo/a na fungicidy na bázi cyklických imidů. Je pozoruhodné, že fungicidní účinek těchto látek proti organismům, které jsou resistantní na fungicidy benzimidazol-thiofanatového typu nebo/a na fungicidy na bázi cyklických imidů (označované dále jako „resistantní houba“ nebo „resistantní kmen“) je mnohem vyšší, než fungicidní účinek proti organismům, které jsou citlivé na fungicidy benzimidazol-thiofanatového typu nebo/a na fungicidy na bázi cyklických imidů (označované dále jako „citlivá houba“ nebo „citlivý kmen“).

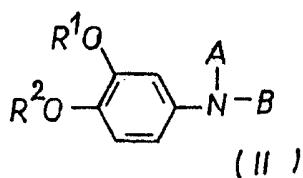
Některé N-(3,4-dialkoxyfenyl)karbamáty již byly syntetizovány, například N-(3,4-dimethoxyfenyl)karbamáty (C. A., 28, 2339; 50, 5674e), 2-chlorethyl-N-(3-methoxy-4-oktyloxyfenyl)karbamát (C. A., 55, 13376f; 55, 21021b), 2-chlorethyl-N-(3-methoxy-4-butoxyfenyl)karbamát (C. A., 64, 8063g), ethyl-N-(3-methoxy-4-oktyloxyfenyl)karbamát (C. A., 68, 39300b) a jsou tudiž známé. V žádné z těchto publikací se však neuvádí nic o fungicidním účinku proti houbám resistantního kmene a také nic o jejich použití jako fungicidů.

Předmětem předloženého vynálezu je tudíž fungicidní prostředek, který se vyznačuje tím, že obsahuje jako účinnou složku fungicidně účinné množství alespoň jednoho shora definovaného N-fenylkarbamátu obecného vzorce I spolu s inertním nosičem nebo ředitlem.

Prostředek podle vynálezu se používá k potírání fytopatogenních hub, které zahrnují resistantní a citlivé kmeny aplikací fungicidně účinného množství N-fenylkarbamátu vzorce I na fytopatogenní houby.

Fenylkarbamáty obecného vzorce I, v němž R^1 , R^2 , R^3 , X, Y a Z mají shora uvedené významy s omezením, že když R^1 znamená methylovou skupinu, symbol R^2 neznamená ani methylovou ani butylovou skupinu, jsou novými sloučeninami.

Předmětem předloženého vynálezu je rovněž způsob výroby těchto nových N-fenylkarbamátů obecného vzorce I, který spočívá v tom, že se nechá reagovat derivát a-nilinu obecného vzorce II



v němž

A znamená vodík a
B znamená skupinu $-Z$ nebo skupinu
 $-C(=X)-YR^3$ nebo
A a B znamenají společně skupinu
 $=C=X$, a
R¹, R², R³, X, Y a Z mají shora uvedené
významy,
se sloučeninou obecného vzorce III



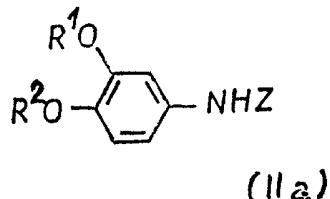
v němž

D znamená skupinu $-C(=X)-YR^3$, $-YR^3$
nebo $-Z$ a

E znamená vodík nebo halogen, a
R³, X, Y a Z mají shora uvedené významy.
Při uvedené reakci je zapotřebí volit re-
akční složky tak, aby vznikla požadovaná
sloučenina obecného vzorce I.

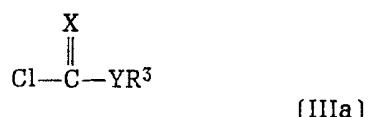
Konkrétní provedení postupu podle vyná-
lezu je blíže objasněno na následujících
třech variantách postupu podle vynálezu:

a) Podle tohoto provedení se N-fenylkar-
bamáty obecného vzorce I získávají reakcí
3,4-dialkoxyanilinu obecného vzorce IIa



v němž

R¹, R² a Z mají shora uvedené významy,
s chlormravenčanem obecného vzorce IIIa

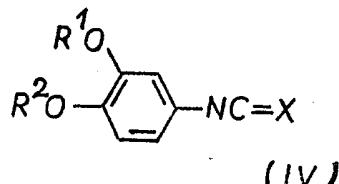


v němž

R³, X a Y mají shora definované významy.
Tato reakce se obvykle provádí v přítom-
nosti inertního rozpouštědla (například
benzenu, toluenu, xylenu, diethyletheru, tet-
rahydrofuranu, dioxanu, chloroformu, tet-
rachlormethanu, ethylacetátu, pyridinu, di-
methylformamidu). Pokud je to žádoucí,
může se reakce provádět v přítomnosti de-
hydrohalogeničního činidla (například py-

ridinu, triethylaminu, diethylanilinu, hydro-
xidu sodného, hydroxidu draselného, hydri-
du sodného) za účelem získání reakčního
produkту vzorce I ve vysokém výtěžku. Re-
akce se může provádět při teplotě od 0 do
150 °C a proběhne okamžitě nebo až do 12
hodin.

b) Podle tohoto provedení lze vyrábět N-
-fenylkarbamáty obecného vzorce I, v němž
Z znamená vodík, reakcí 3,4-dialkoxyfenyl-
isokyanátů nebo -isothiokyanátů obecného
vzorce IV



v němž

R¹, R² a X mají shora definované významy,
s alkoholem nebo thiolem obecného vzorce
V

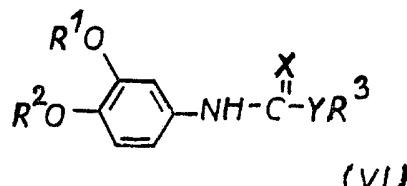


v němž

R³ a Y mají shora uvedené významy.

Tato reakce se obvykle provádí za nepří-
tomnosti nebo v přítomnosti inertního roz-
pouštědla (například benzenu, toluenu, xy-
lenu, diethyletheru, tetrahydrofuranu, dio-
xanu, dimethylformamidu, chloroformu, tet-
rachlormethanu). Pokud je to žádoucí, může
se použít katalyzátor, například triethylam-
in, diethylanilin nebo 1,4-diazabicyklo-[2,2,2]oktan. Reakce se obvykle provádí při
teplotě od 0 do 50 °C a proběhne okamžitě
nebo do 12 hodin.

c) Podle tohoto provedení lze vyrábět N-
-fenylkarbamáty obecného vzorce I, v němž
Z má jiný význam než vodík, reakcí N-(3,4-
-dialkoxyfenyl)karbamátu obecného vzorce
VI



v němž

R¹, R², R³, X a Y mají shora uvedený vý-
znam,
s halogenidem obecného vzorce VII



v němž

X má shora definovaný význam s výjim-
kou vodíku, a

A' znamená atom halogenu, například chloru nebo bromu.

Tato reakce se obvykle provádí v inertním rozpouštědle (například v benzenu, toluenu, xylenu, diethyletheru, tetrahydrofuranu, dioxanu, chloroformu, tetrachlormetanu, ethylacetátu, pyridinu nebo dimethylformamidu). Pokud je to žádoucí, může se reakce provádět v přítomnosti dehydrohalogenačního činidla (například pyridinu, triethylaminu, diethylanilinu, hydroxidu sodného, hydroxidu draselného, hydridu sodného) a katalyzátoru (například tetra-butylamoniumbromidu) k získání požadovaného reakčního produktu vzorce I ve vysokém výtěžku. Reakce se může provádět při teplotě od 0 do 150 °C a probíhá okamžitě nebo až do 12 hodin.

V obecném vzorci I mají obecné symboly následující výhodné významy: R¹ a R² znamenají výhodně každý zvlášť methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, n-butylallyl, propargyl, difluormethyl, 2-chlorethyl, 2,2,2-trifluorethyl; R³ znamená methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, sek.butyl, 1-ethylpropyl, 1-methylbutyl, 1-ethylbutyl, 1,3-dimethylbutyl, 1-methylheptyl, allyl, 1-methyl-2-propenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 2-methyl-2-propenyl, 1-ethyl-2-propenyl, 1-methyl-3-butenyl, 1-pentyl-2-propenyl, propargyl, 1-methyl-2-propinyl, 2-butinyl, 3-butinyl, 1-ethyl-2-propinyl, 1-methyl-3-butinyl, 1-butyl-2-propinyl, 1-pentyl-2-propinyl, cyklobutyl, 2-fluorethyl, 2-chlorethyl, 2,2-dichlorethyl, 1-methyl-2-bromethyl, 1-fluormethyl-2-fluorethyl, 1-brommethyl-2-bromethyl, 1-methyl-2,2,2-trichlorethyl, 1-ethyl-2-bromethyl, 4-chlor-2-butenyl, 4-chlor-2-butinyl, 2-kyanethyl, 2-allyloxyethyl, 2-(2-chlorethoxy)ethyl, 2-benzoyloxyethyl, 1-chlormethyl-2-methoxyethyl, cyklopropylmethyl,

1-cyklopropylethyl, 1-cyklopentylethyl, 3-furylethyl,

1-fenylethyl
nebo 3-tetrahydrofuranyl,
X a Y znamenají každý kyslík nebo síru a X znamená vodík, methyl, ethyl, n-butyl, allyl, acetyl, propionyl, n-pantanoyl, sek.pantanoyl, cyklopropankarbonyl, benzoyl, 2-chlorbenzoyl, 2,4-dichlorbenzoyl, 4-methylbenzoyl, methansulfonyl nebo ethoxykarbonylmethyl.

N-fenylkarbamáty vzorce I jsou fungicidně účinné proti širokému spektru fytopatogenních hub, jako je například padlý jablonové (*Podosphaera leucotricha*), strupovitost jabloní (*Venturia inaequalis*), *Mycosphaerella pomi*, *Marssonina mali* a *Sclerotinia mali* na jabloni, *Phyllactinia kakicola* a *Gloeosporium kaki* na černodrvu, *Cladosporium carpophilum* a *Phomopsis sp.* na broskvoni, *Cercospora viticola*, padlý révové (*Uncinula necator*), antraknóza (*Elsinoe ampelina*) a *Glomerella cingulata* na citrusovníku největším, *Cercospora arachidicola* a *Cercospora personata* na podzemníci olejně, skvrnatička řepná (*Cercospora beticola*) na cukrovce, padlý travní (*Erysiphe graminis f. sp. hordei*), *Cercosporella herpotrichoides* a *Fusarium nivale* na ječmeni, padlý travní (*Erysiphe graminis f. sp. tritici*) na pšenici, *Sphaeroteca fuliginea* a čerň okurková (*Cladosporium cucumerinum*) na okurkách, *Cladosporium fulvum* na rajčeti, suchá skvrnitost listů (*Corynespora melongenae*) na lilek, *Sphaerotheca humuli*, fuzáriová hniloba cibule (*Fusarium oxysporum f. sp. fragariae*) na jahodníku, *Botrytis allii* na cibuli, cerkosporioza celeru (*Cercospora appi*) na celeru, *Phaeoisariopsis griseola* na fazolu, padlý (*Erysiphe cichoracearum*) na tabáku, *Diplocarpon rosae* na růžích, *Elsinoe fawcetti*, *Penicillium italicum*, *Penicillium digitatum* na pomerančovnících, *Botrytis cinerea* na okurkách, lilek, rajčeti, jahodníku, paprikovém lusku, cibuli, hlávkovém salátu, citrusovníku největším, pomerančovníku, bramboríku, růžích nebo chmelu, hlízenka obecná (*Sclerotinia sclerotiorum*) na okurkách, lilek, paprikovém lusku, hlávkovém salátu, celeru, fazolu, sojovém bobu, rajčeti nebo slunečnic, *Sclerotina cinerea* na broskvoni nebo třešni, *Mycosphaerella melonis* na okurce nebo melounu, atd. Zejména pak mají N-fenylkarbamáty vzorce I vysokou účinnost při potírání resistentních kmenů uvedených druhů hub.

N-fenylkarbamáty vzorce I jsou také fungicidně účinné proti houbám, které jsou citlivé vůči uvedeným známým fungicidům, stejně dobře jako proti houbám, vůči kterým jsou uvedené známé fungicidy neúčinné. Jako příklady takových hub lze uvést *Pyricularia oryzae*, *Pseudoperonospora cubensis*, *perenospora révy vinné* (*Plasmopara*

ra viticola), plíseň bramborová (*Phytophthora infestans*) atd.

Je výhodné, že N-fenylkarbamáty vzorce I mají nepatrnou toxicitu a mají nepatrný zhoubný účinek na savce, ryby apod. Mohou se také aplikovat na zemědělské pozemky bez nebezpečí toxicity vůči důležitým kulturním plodinám.

Vzhledem k výtečným fungicidním vlastnostem jsou výhodné sloučeniny obecného vzorce I, v němž R¹ a R² znamenají nezávisle na sobě methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, allyl, propargyl, difluormethyl, 2-chlorethyl, 2,2,2-trifluorethyl, R³ znamená methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, sek.butyl, 1-ethylpropyl, 1-methylbutyl, 1-ethylbutyl, 1,3-dimethylbutyl, 1-methylheptyl, allyl, 1-methyl-2-propenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 2-methyl-2-propenyl, 1-ethyl-2-propenyl, 1-methyl-3-butenyl, 1-pentyl-2-propenyl, propargyl, 1-methyl-2-propinyl, 2-butinyl, 3-butinyl, 1-ethyl-2-propinyl, 1-methyl-3-butinyl, 1-butyl-2-propinyl, 2-fluorethyl, 1-methyl-2-bromethyl, 1-fluormethyl-2-fluorethyl, 1-brommethyl-2-bromethyl, 4-chlor-2-butinyl, 1-methyl-2-methoxyethyl, 1-cyklopropyl-ethyl nebo 1-fenylethyl, X znamená kyslík, Y znamená kyslík nebo síru, a Z znamená vodík, acetyl, propionyl, n-pantanoyl, sek.pantanoyl, cyklopropankarbonyl, benzoyl, 2-chlorbenzoyl, 2,4-dichlorbenzoyl nebo 4-methylbenzoyl, s tím omezením, že když R¹ znamená methyl, R² neznamená methyl.

4-methylbenzoyl, methansulfonyl nebo ethoxykarbonylmethyl, s tím omezením, že když R¹ znamená methyl, R² neznamená methyl ani butyl.

Zvláště výhodné jsou sloučeniny obecného vzorce I, v němž R¹ a R² znamenají nezávisle na sobě methyl, ethyl, n-propyl, allyl nebo propargyl, R³ znamená ethyl, isopropyl, sek.butyl, 1-methylbutyl, 1-ethylpropyl, 1-ethylbutyl, 1-methyl-2-propenyl, 1-ethyl-2-propenyl, 1-methyl-3-butinyl, propargyl, 1-methyl-2-propinyl, 1-ethyl-2-propinyl, 3-butinyl, 1-methyl-3-butinyl, 1-butyl-2-propinyl, 2-fluorethyl, 1-methyl-2-bromethyl, 1-fluormethyl-2-fluorethyl, 1-brommethyl-2-bromethyl, 4-chlor-2-butinyl, 1-methyl-2-methoxyethyl, 1-cyklopropyl-ethyl nebo 1-fenylethyl,

X znamená kyslík, Y znamená kyslík nebo síru, a Z znamená vodík, acetyl, propionyl, n-pantanoyl, sek.pantanoyl, cyklopropankarbonyl, benzoyl, 2-chlorbenzoyl, 2,4-dichlorbenzoyl nebo 4-methylbenzoyl, s tím omezením, že když R¹ znamená methyl, R² neznamená methyl.

Ještě výhodnější jsou sloučeniny obecného vzorce I, v němž R¹ a R² znamenají každý ethyl, R³ znamená ethyl, isopropyl, sek.butyl, 1-methylbutyl, 1-ethylbutyl, 1-methyl-3-butinyl, 1-methyl-2-propinyl, 4-chlor-2-butinyl nebo 1-fenylethyl, X znamená kyslík, Y znamená kyslík nebo síru a Z znamená vodík, acetyl, cyklopropankarbonyl, benzoyl nebo 2-chlorbenzoyl.

Mezi nejvýhodnější ze sloučenin vzorce I náleží následující sloučeniny:

isopropyl-N-(3,4-diethoxyfenyl)-karbamát,
1-methyl-2-propinyl-N-(3,4-diethoxyfenyl)-karbamát,
4-chlor-2-butinyl-N-(3,4-diethoxyfenyl)-karbamát,
isopropyl-N-(3,4-diethoxyfenyl)-thiolkarbamát,
1-fenylethyl-N-(3,4-diethoxyfenyl)-karbamát,
isopropyl-N-acetyl-N-(3,4-diethoxyfenyl)karbamát,
isopropyl-N-cyklopropankarbonyl-N-(3,4-diethoxyfenyl)karbamát,
isopropyl-N-benzoyl-N-(3,4-diethoxyfenyl)karbamát.

isopropyl-N-(2-chlorbenzoyl)-N-(3,4-diethoxyphenyl)karbamát atd.

Následující příklady ilustrují některé typické způsoby přípravy N-fenylkarbamátů obecného vzorce I.

Příklad 1

Příprava isopropyl-N-(3,4-diethoxyphenyl)-karbamátu [podle postupu a]):

1,8 g 3,4-diethoxyanilinu a 1,5 g diethylanilinu se rozpustí ve 20 ml benzenu. K výslednému roztoku se přikape isopropylester chlormravenčí kyseliny (1,2 g) během 5 minut za chlazení ledem. Potom se reakční směs ponechá 3 hodiny při teplotě místnosti, načež se vylije do ledové vody a provede se extrakce etherem. Extrakt se promyje vodou, vysuší se síranem hořečnatým a zahustí se za sníženého tlaku za vzniku 2,6 g surových krystalů. Překrystalováním z ethanolu se získá 2,3 g isopropyl-N-(3,4-diethoxyphenyl)karbamátu (sloučenina číslo 13). Výtěžek odpovídá 86 % teorie. Teplota tání 100 až 100,5 °C.

Analýza pro C₁₄H₂₁NO₄:

vypočteno
62,90 % C, 7,92 % H, 5,24 % N;

nalezeno
62,75 % C, 7,96 % H, 5,41 % N.

Příklad 2

Příprava isopropyl-N-(3,4-diethoxyphenyl)-thiolkarbamátu [podle postupu b]):

1 g triethylaminu a 0,8 g isopropylmerkaptanu se rozpustí ve 20 ml toluenu. V výslednému roztoku se přikape během 5 minut za chlazení ledem 2,1 g 3,4-diethoxyfenylisokyanátu. Potom se reakční směs ponechá stát 12 hodin při teplotě místnosti, načež se reakční směs vylije do ledové vody a provede se extrakce toluenem. Extrakt se promyje vodou, vysuší se síranem hořečnatým a zahustí se za sníženého tlaku. Zbytek se čistí sloupcovou chromatografií na silikagelu za použití směsi hexanu a acetolu jako elučního činidla. Získá se 3,1 g isopropyl-N-benzoyl-N-(3,4-diethoxyphenyl)-karbamátu (sloučenina č. 99). Výtěžek odpovídá 80 % teorie. Teplota tání 120 až 121 °Celsia.

činidla. Získá se 2,7 g isopropyl-N-(3,4-diethoxyphenyl)thiolkarbamátu (sloučenina čís. 88) v 87% výtěžku. Teplota tání 110 až 111 °Celsia.

Elementární analýza pro C₁₄H₂₁NO₅S:

vypočteno
59,33 % C, 7,47 % H, 4,94 % N, 11,32 % S;

nalezeno
59,02 % C, 7,51 % H, 4,89 % N, 11,70 % S.

Příklad 3

Příprava isopropyl-N-benzoyl-N-(3,4-diethoxyphenyl)karbamátu [podle postupu c]):

2,7 g isopropyl-N-(3,4-diethoxyphenyl)karbamátu se rozpustí v 50 ml dimethylformamidu a k tomuto roztoku se přidá 0,5 g 50% disperze hydridu sodného. Směs se zahřívá na teplotu 60 °C po dobu 15 minut, potom se přidá 1,4 g benzoylchloridu a reakční směs se zahřívá 30 minut. Reakční směs se vylije do ledové vody a extrahuje se etherem. Etherický extrakt se promyje roztokem hydrogenuhličitanu sodného a nasyceným roztokem chloridu sodného, vysuší se bezvodým síranem hořečnatým a filtrát se zahustí za sníženého tlaku. Zbytek se čistí sloupcovou chromatografií na silikagelu za použití směsi hexanu a acetolu jako elučního činidla. Získá se 3,1 g isopropyl-N-benzoyl-N-(3,4-diethoxyphenyl)-karbamátu (sloučenina č. 99). Výtěžek odpovídá 80 % teorie. Teplota tání 120 až 121 °Celsia.

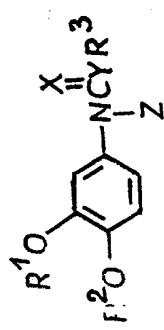
Elementární analýza pro C₂₁H₂₅NO₅:

vypočteno
67,90 % C, 6,78 % H, 3,77 % N;

nalezeno
68,11 % C, 6,61 % H, 3,90 % N.

Podle některého ze shora uvedených postupů a), b) nebo c) lze připravit N-fenylkarbamáty vzorce I, které jsou uvedeny v následující tabulce 1:

Tabulka 1

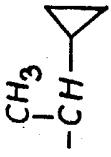
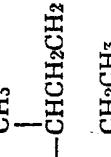
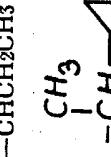


sloučenina číslo	R ¹	R ²	R ³	X Y Z			fyzikální vlastnosti
				X	Y	Z	
1	-CH ₃	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso)	0	0	H	t. t. 104-105 °C
2	-CH ₃	-C ₂ H ₅	C≡CH -CHCH ₃	0	0	H	t. t. 133-134 °C
3	-CH ₃	-C ₂ H ₅	CH ₃ -CHCH ₂ OCH ₃	0	0	H	t. t. 54-55 °C
4	-CH ₃	-C ₃ H ₇ (n)	-C ₃ H ₇ (iso) -C ₃ H ₇ (iso)	0	0	H	t. t. 94-95 °C
5	-CH ₃	-CH ₂ CH=CH ₂	0	0	H	t. t. 79-80 °C	
6	-CH ₃	-CH ₂ CH=CH ₂	C≡CH -CHCH ₃	0	0	H	t. t. 106-107 °C
7	-CH ₃	-CH ₂ C≡CH	-C ₃ H ₇ (iso) -C ₃ H ₇ (iso)	0	0	H	n _D ¹⁹ 1,5269
8	-CH ₃	-CH ₃	0	0	H	t. t. 103-104 °C	
9	-C ₂ H ₅	-CH ₃	0	0	H	t. t. 110,5-111,5 °C	
10	-C ₂ H ₅	-CH ₃	-CH ₂ C≡CCH ₂ Cl	0	0	H	t. t. 96-97 °C
11	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₃	0	0	H	t. t. 120-121 °C
12	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	0	0	H	t. t. 90-91 °C
13	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	0	0	H	t. t. 100-100,5 °C
14	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₄ H ₉ (sek.)	0	0	H	t. t. 97-98 °C

sloučenina číslo	R ¹	R ²	R ³	X	Y	Z	fyzikální vlastnosti
15	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₃ -CH(CH ₂) ₂ CH ₃	0	0	H	t. t. 67—68 °C
16	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₃ -CHCH ₂ CH ₃	0	0	H	t. t. 93—94 °C
17	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₃ -CH(CH ₂) ₂ CH ₃	0	0	H	t. t. 87—88 °C
18	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₃ CH ₃ -CHCH ₂ CHCH ₃	0	0	H	t. t. 56—57 °C
19	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₃ -CH(CH ₂) ₅ CH ₃	0	0	H	t. t. 46,5—48 °C
20	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH=CH ₂	0	0	H	t. t. 86—87 °C
21	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₃ -CHCH=CH ₂	0	0	H	t. t. 98—99,5 °C
22	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	0	0	H	t. t. 92,5—93,5 °C
23	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₃ -CH ₂ C=CH ₂	0	0	H	t. t. 92—93 °C
24	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₃ -CHCH=CH ₂	0	0	H	t. t. 98,5—99,5 °C

sloučenina číslo	R ¹	R ²	R ³	X	Y	Z	fyzikální vlastnosti
25	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—CH ₃ CH=CH ₂	0	0	H	t. t. 75—76 °C
26	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—CH(CH ₂) ₄ CH ₃	0	0	H	t. t. 46,5—48 °C
27	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—CH ₂ C≡CH	0	0	H	t. t. 111—112 °C
28	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—CHC≡CH	0	0	H	t. t. 116—117 °C
29	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—CH ₂ CH ₂ C≡CH	0	0	H	t. t. 89—90 °C
30	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—CH ₂ CH ₃ CH≡CH	0	0	H	t. t. 118—119 °C
31	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—CHCH ₂ C≡CH	0	0	H	t. t. 99—100 °C
32	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—CH(CH ₂) ₃ CH ₃ C≡CH	0	0	H	t. t. 120—121 °C
33	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—CH(CH ₂) ₄ CH ₃ C≡CH	0	0	H	t. t. 96—97 °C
34	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅ 	0	0	H	t. t. 114—115,5 °C
35	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—CH ₂ CH ₂ F	0	0	H	t. t. 101—102 °C

sloučenina číslo	R ¹	R ²	R ³	X	Y	Z	fyzikální vlastnosti
36	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ Cl	0	0	H	t, t, 89,5-90,5 °C
37	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CHCl ₂	0	0	H	t, t, 73-74 °C
38	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₃ -CHCH ₂ Br	0	Q	H	t, t, 69-70 °C
39	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₂ F -CHCH ₂ F	0	Q	H	t, t, 89-90 °C
40	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₂ Br -CHCH ₂ Br	0	Q	H	t, t, 75-76 °C
41	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₃ -CHCCl ₃	Q	Q	H	n _D ^{20,5} 1,53316
42	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH=CHCH ₂ Cl	0	0	H	t, t, 82-83 °C
43	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₂ C≡CCH ₂ Cl	0	0	H	t, t, 112-113 °C
44	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	0	0	H	t, t, 58-59 °C
45	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CH≡CH ₂	0	0	H	t, t, 77-78 °C
46	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₃ -CHCH ₂ OCH ₃	0	0	H	t, t, 65-66,5 °C
47	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₃ -CHCH ₂ O(CH ₂) ₃ CH ₃	0	0	H	t, t, 36-38 °C
48	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₂ Cl -CHCH ₂ OCH ₃	0	0	H	t, t, 82-83 °C
49	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ CN	0	0	H	t, t, 85,5-86,5 °C

sloučenina číslo	R ¹	R ²	R ³	X	Y	Z	fyzikální vlastnosti
50	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₆		0	0	H	t. t. 107—108 °C
51	—C ₂ H ₅	—C ₃ H ₇ (n)	—C ₂ H ₅	0	0	H	t. t. 74—75 °C
52	—C ₂ H ₅	—C ₃ H ₇ (n)	—C ₃ H ₇ (iso)	0	0	H	t. t. 97—98 °C
53	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₆		0	0	H	t. t. 99—100 °C
54	—C ₂ H ₅	—C ₄ H ₉ (n)	—C ₃ H ₇ (iso)	0	0	H	t. t. 110—111 °C
55	—C ₂ H ₅	—C ₄ H ₉ (n)		0	0	H	t. t. 87—88 °C
56	—C ₂ H ₅	—CH ₂ C≡CH	—C ₃ H ₇ (iso)	0	0	H	t. t. 102—103 °C
57	—C ₃ H ₇ (n)	—CH ₃	—C ₃ H ₇ (iso)	0	0	H	t. t. 101—102 °C
58	—C ₃ H ₇ (n)	—C ₂ H ₅	—CH ₃	0	0	H	t. t. 85—86 °C
59	—C ₃ H ₇ (n)	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	0	0	H	t. t. 76,5—77,5 °C
60	—C ₃ H ₇ (n)	—C ₂ H ₅	—C ₃ H ₇ (iso)	0	0	H	t. t. 81,82 °C
61	—C ₃ H ₇ (n)	—C ₂ H ₅		0	0	H	t. t. 83—84 °C
62	—C ₃ H ₇ (n)	—C ₂ H ₅	—CH ₂ CH ₃	0	0	H	t. t. 90—91 °C
63	—C ₃ H ₇ (n)	—C ₂ H ₅		0	0	H	t. t. 82—83 °C
64	—C ₃ H ₇ (n)	—C ₂ H ₅	—CH ₂ CH ₂ F	0	0	H	t. t. 82—83 °C
65	—C ₃ H ₇ (n)	—C ₃ H ₇ (n)	—C ₃ H ₇ (iso)	0	0	H	t. t. 85—86 °C

sloučenina číslo	R ¹	R ²	R ³	X	Y	Z	fyzikální vlastnosti
66	-C ₃ H ₇ (iso)	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso)	0	0	H	n _D ¹⁹ 1,5121
67	-C ₃ H ₇ (iso)	-C ₂ H ₅	CH ₃ -CHC≡CH	0	0	H	t. t. 100,5—102 °C
68	-C ₃ H ₇ (iso)	-C ₂ H ₅	CH ₃ -CHCH ₂ OCH ₃	0	0	H	n _D ¹⁹ 1,5092
69	-C ₄ H ₉ (n)	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso) -C ₃ H ₇ (iso) -CH ₂ CH=CH ₂ -CH ₂ CH=CH ₂ -CH ₂ CH=CH ₂	0	0	H	t. t. 79,5—81 °C
70	-C ₃ H ₇ (n)	-C ₃ H ₇ (n)	-CH ₂ CH=CH ₂ -CH ₂ C≡CCH ₃	0	0	H	t. t. 82—83 °C
71	-C ₃ H ₇ (n)	-C ₃ H ₇ (n)	-CH ₂ C≡CCH ₃	0	0	H	t. t. 66—67 °C
72	-C ₃ H ₇ (n)	-C ₃ H ₇ (n)	C≡CH -CHCH ₃	0	0	H	t. t. 92—93 °C
73	-CH ₂ CH=CH ₂	-C ₃ H ₇ (n)	-C ₃ H ₇ (iso) -CH ₂ CH=CH ₂ -C ₂ H ₅ -CH ₂ C≡CH -CHF ₂	0	0	H	t. t. 84—85,5 °C
74	-CH ₂ CH=CH ₂	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso) -C ₃ H ₇ (iso) -C ₃ H ₇ (iso) -C ₃ H ₇ (iso) -CHF ₂	0	0	H	t. t. 83,5—84,5 °C
75	-CH ₂ CH=CH ₂	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -CH ₂ H ₂	0	0	H	t. t. 101—102 °C
76	-CH ₂ CH=CH ₂	-C ₂ H ₅	-CH ₂ C≡CH	0	0	H	t. t. 103—104 °C
77	-CHF ₂	-C ₂ H ₅	-CH ₂ C≡CH	0	0	H	n _D ²² 1,4671
78	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -CH ₂ H ₂	0	0	H	t. t. 73—74 °C
79	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₂ H ₂ -CH ₂ H ₂	0	0	H	t. t. 95—96 °C
80	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₃ -CH—Cyclopentyl	0	0	H	t. t. 105—106 °C
81	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₃ -CHCH ₂ Br	0	0	H	t. t. 68—69 °C

sloučenina číslo	R ¹	R ²	R ³	X	Y	Z	fyzikální vlastnosti
82	-CH ₂ CH ₂ Cl	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso)	0	0	H	t. t. 111-112 °C
83	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (n)	0	0	H	t. t. 79-80 °C
84	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅		0	0	H	t. t. 117-118 °C
85	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₂ 	0	0	H	t. t. 111,5-112,5 °C
86	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	CH ₃ -CH- 	0	0	H	t. t. 109-110 °C
87	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	0	S	H	t. t. 107-108 °C
88	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso)	0	S	H	t. t. 110-111 °C
89	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH=CH ₂	0	S	H	t. t. 73-76 °C
90	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	0	O	CH ₃	n _D ²⁵ 1,5059
91	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso)	0	O	CH ₃	n _D ²⁵ 1,4922
92	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	0	O	CH ₃	n _D ^{26,5} 1,4885
93	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso)	0	O	CH ₂ CH=CH ₂	n _D ^{26,5} 1,5044
94	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso)	0	O	COCH ₃	t. t. 98-99 °C
95	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso)	0	O	CO ₂ H ₅	n _D ^{27,5} 1,5006
96	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso)	0	O	CO ₂ H _{9(n)}	t. t. 63-65 °C
97	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso)	0	O	CO ₂ H ₉ (sek.)	n _D ²⁸ 1,4889
98	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso)	0	O	-CO-	t. t. 55-57 °C
99	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso)	0	O	-CO-	t. t. 120-121 °C
100	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-C ₃ H ₇ (iso)	0	O	-CO-	n _D ²⁸ 1,5371

sloučenina číslo	R ¹	R ²	R ³	X	Y	Z	fyzikální vlastnosti
101	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—C ₃ H ₇ (iso)	0	0	—CO—  —C ₁	n ^{28.5} 1,5349
102	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—C ₃ H ₇ (iso)	0	0	—CO—  —CH ₃	t. t. 102—103 °C
103	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	 —CHCH ₂ OCH ₃	0	0	—COC ₂ H ₅	n _D ²⁷ 1,4972
104	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—C ₃ H ₇ (iso)	0	0	—SOCH ₃	t. t. 114—115 °C
105	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—C ₃ H ₇ (iso)	0	0	—CH ₂ COOC ₂ H ₅	n _D ^{27.5} 1.4948
106	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—C ₂ F ₅	S	O	H	t. t. 74—75 °C
107	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	S	O	H	t. t. 87—88 °C
108	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—C ₄ H ₉ (sek.)	O	S	H	t. t. 97—98 °C
109	—C ₂ H ₅	—C ₂ H ₅	—C ₃ H ₇ (iso)	S	S	H	t. t. 64—65 °C

236688

Při praktickém upotřebení N-fenylkarbamátů obecného vzorce I jako fungicidů, se mohou tyto látky aplikovat jako takové nebo ve formě prostředků jako popraší, smáčitelných prášků, olejových sprayů, emulgovatelných koncentrátů, tablet, granulátů, mikrogranulátů, aerosolů nebo suspenzí. Takovéto prostředky lze připravovat běžným způsobem smísením alespoň jednoho N-fenylkarbamátu obecného vzorce I s vhodnými pevnými nebo kapalnými nosnými látkami nebo ředitly, a popřípadě s vhodnými pomocnými přípravky (jako jsou například povrchově aktivní činidla, adheziva, dispergátory nebo stabilizátory) ke zlepšení dispergovatelnosti nebo dalších vlastností účinné látky či účinných láték.

Jako příklady pevných nosných láték nebo ředitel lze uvést rostlinné materiály (například ve formě moučky, prášek z tabákových stonků, práškové sójové bobry, prášek ze skořápek ořechů, rostliny ve formě prášku, piliny, otruby, rozemletá kůra stromů, prášková celulóza, zbytky po extrakci rostlin), vláknité materiály (například papír, vlnitá lepeňka, staré hadry), práškové plastické hmoty, hlinky (například kaolin, bentonit, fulárská hlinka), mastek, další anorganické materiály (například pyrofilit, sericit, pemza, prášková síra, aktivní uhlí) a umělá hnojiva (například síran amonný, fosforečnan amonný, dusičnan amonný, močovina, chlorid amonný).

Jako příklady kapalných nosných láték nebo ředitel lze uvést vodu, alkoholy (například methanol, ethanol), ketony (například aceton, methylethylketon), ethery (například diethylether, dioxan, glykolethylether, tetrahydrofuran), aromatické uhlovodíky (například benzen, toluen, xylen, methylnaftalen), alifatické uhlovodíky (například gasolin, petrolej, olej na svícení), estery, nitrily, amidy kyselin (například dimethylformamid, dimethylacetamid), halogenované uhlovodíky (například dichlor Ethan, tetrachlormethan) atd.

Jako příklady povrchově aktivních činidel lze uvést alkylestery kyseliny sírové, alkylsulfonáty, alkylarylsulfonáty, polyethyleglykolethery, estery vícemocných alkoholů, atd. Příklady adhezív a dispergátorů mohou zahrnovat kasein, želatinu, práškový škrob, karboxymethylcelulózu, arabskou gumu, alginovou kyselinu, lignin, bentonit, melasu, polyvinylalkohol, terpentinový olej a agar. Jako stabilizátorů je možno používat směsi isopropylfosfátů, trikresylfosfátů, epoxidovaného oleje, různých povrchově aktivních láték, různých mastných kyselin a jejich esterů atd.

Shora uvedené prostředky obsahují obecně alespoň jeden N-fenylkarbamát vzorce I

v koncentraci asi 1 až 95 % hmotnostních, výhodně od 2 do 80 % hmotnostních. Při aplikaci těchto prostředků se N-fenylkarbamát používá obecně v množství od 20 do 1000 g na 1 ha.

Fungicidní prostředek podle vynálezu je možno používat také ve směsi s dalšími fungicidy, herbicidy, insekticidy, akaricidy, hnojivy atd.

Používají-li se N-fenylkarbamáty vzorce I jako fungicidy, mohou se aplikovat v množství od 20 do 1000 g na 1 ha. Uvedené množství, které se aplikuje je závislé na formě přípravku, době aplikace, způsobu aplikace, na místě, kde se aplikace provádí, na stupni choroby, na použité plodině a není tudíž omezeno na shora uvedené přesné množství.

V další části jsou uvedeny některé praktické příklady fungicidních prostředků podle vynálezu, přičemž v uvedených příkladech jsou procenty a díly mírněna procenta hmotnostní a díly hmotnostní.

Příklad 1

2 díly sloučeniny č. 21, 88 dílů kaolinu a 10 dílů mastku se důkladně rozemle na práškovou směs, přičemž se získá popraš obsahující 2 % účinné látky.

Příklad 2

30 dílů sloučeniny č. 11, 45 dílů křemeliny, 20 dílů koloidního kysličníku křemičitého, 3 díly natriumlaurylsulfátu jako smáčedla a 2 díly vápenaté soli ligninsulfonové kyseliny jako dispergátoru se smísí za rozemletí na prášek, přičemž se získá smáčitelný prášek obsahující 30 % účinné látky.

Příklad 3

5 dílů sloučeniny č. 13, 45 dílů křemeliny, 2,5 dílu vápenaté soli alkylbenzensulfonové kyseliny jako smáčedla a 2,5 dílu vápenaté soli ligninsulfonové kyseliny jako dispergátoru se smísí za rozemletí na prášek, přičemž se získá smáčitelný prášek, který obsahuje 50 % účinné látky.

Příklad 4

10 dílů sloučeniny č. 46, 80 dílů cyklohexanonu a 10 dílů polyoxyethylenalkyletheru jako emulgátoru se vzájemně smísí, přičemž se získá emulgovatelný koncentrát obsahující 10 % účinné látky.

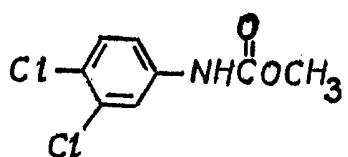
V další části jsou uvedeny výsledky typických testů, které ilustrují výtečnou fungicidní účinnost N-fenylkarbamátů vzorce I.

Ke srovnání bylo použito následujících známých sloučenin:

sloučenina

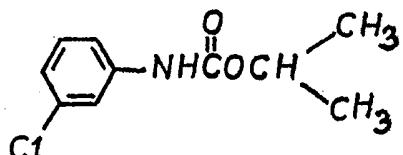
poznámky

Swep



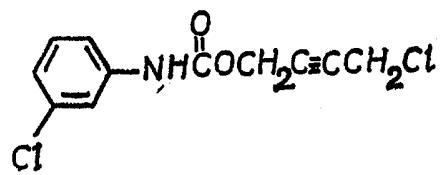
komerčně použitelný herbicid

Chlorpropham



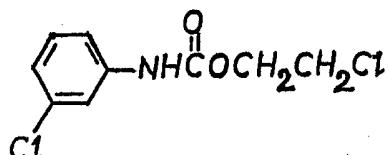
komerčně použitelný herbicid

Barban



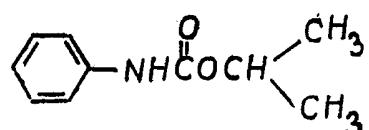
komerčně použitelný herbicid

CEPC



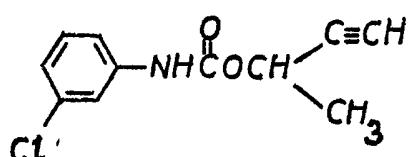
komerčně použitelný herbicid

Propham



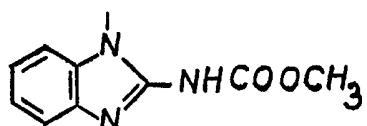
komerčně použitelný herbicid

Chlorbufam



komerčně použitelný herbicid

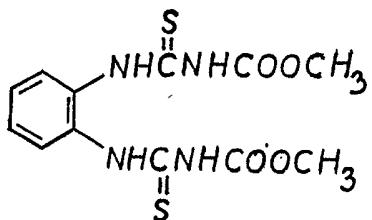
Benomyl

CONHC₄H₉

komerčně použitelný fungicid

sloučenina

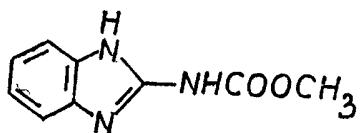
Thiophanata-methyl



Carbendazim

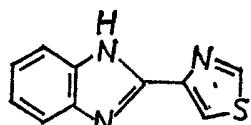
poznámky

komerčně použitelný fungicid



Thiabendazole

komerčně použitelný fungicid



komerčně použitelný fungicid

Test 1

Protektivní účinnost na padlí (Sphaerotheca fuliginea) na okurkách

Květináč o obsahu 90 ml se naplní písčitou půdou a do půdy se zasejí semena o-kurky (varieta Sagami-hanjiro). Rostliny se pěstují ve skleníku po dobu 8 dnů. Na vzešlé klíční rostliny s děložními lístky se postříkem aplikuje testovaná sloučenina ve formě emulgovatelného koncentrátu nebo smáčitelného prášku zředěného vodou v množství 10 ml na 1 květináč. Potom se klíční rostliny inokulují postříkem suspenzí spór padlí Sphaerotheca fuliginea a to jednak resistentního a jednak citlivého kmene a rostliny se dále kultivují ve skle-

níku. 10 dnů poté se určí rozsah choroby na rostlinách. Stupeň poškození se určuje dále uvedeným způsobem. Výsledky testu jsou uvedeny v tabulce 3.

Na zkoumaných listech se změří zamořená plocha (vyjádří se v %) a označí se indexem 0, 0,5, 1, 2 a 4:

index	zamořená plocha v %
0	bez infekce
0,5	zamořeno méně než 5 %
1	zamořeno méně než 20 %
2	zamořeno méně než 50 %
4	zamořeno více než 50 %

Rozsah choroby se vypočítá podle následujícího vzorce:

$$\text{rozsah choroby (\%)} = \frac{\sum (\text{index}) \times (\text{počet listů})}{4 \times (\text{celkový počet zkoumaných listů})} \times 100$$

Preventivní účinnost se vypočte podle následujícího vzorce:

$$\text{preventivní účinnost (\%)} = 100 - \frac{(\text{rozsah choroby na ošetřených rostlinách})}{(\text{rozsah choroby na neošetřených rostlinách})} \times 100$$

Tabulka 3

sloučenina č.	konzentrace účinné látky (ppm)	preventivní účinnost při zamoření resistentním kmenem (%)	preventivní účinnost při zamoření citlivým kmenem (%)
1	200	100	0
2	200	100	0
3	200	100	0
4	200	92	0
5	200	100	0
6	200	100	0
7	200	100	32
8	200	100	0
9	200	100	0
10	200	100	0
11	200	100	0
12	200	100	0
13	200	100	0
14	200	100	0
15	200	100	0
16	200	100	0
17	200	100	0
18	200	100	0
19	200	100	0
20	200	100	0
21	200	100	0
22	200	100	0
23	200	90	0
24	200	100	0
25	200	100	0
26	200	100	0
27	200	100	0
28	200	100	0
29	200	100	0
30	200	100	0
31	200	100	0
32	200	100	0
33	200	84	0
34	200	100	0
35	200	100	26
36	200	97	0
37	200	100	0
38	200	100	34
39	200	100	0
40	200	100	0
41	200	100	0
42	200	82	0
43	200	100	0
44	200	100	0
45	200	100	0
46	200	100	0
47	200	100	0
48	200	100	0
49	200	100	0
50	200	100	0
51	200	100	0
52	200	100	0
53	200	100	0
54	200	100	0
55	200	90	0
56	200	100	0
57	200	100	0
58	200	100	0
59	200	100	0
60	200	100	0
61	200	100	0

sloučenina č.	koncentrace účinné látky (ppm)	preventivní účinnost při zamoření resistentním kmenem [%]	preventivní účinnost při zamoření citlivým kmenem (%)
62	200	100	0
63	200	100	0
64	200	100	0
65	200	86	0
66	200	100	0
67	200	100	52
68	200	100	23
69	200	88	0
70	200	100	0
71	200	100	0
72	200	100	0
73	200	100	0
74	200	100	0
75	200	100	0
76	200	100	0
77	200	90	0
78	200	92	0
79	200	94	0
80	200	100	0
81	200	100	0
82	200	100	0
83	200	100	0
84	200	97	0
85	200	94	0
86	200	100	0
87	200	100	0
88	200	100	0
89	200	92	0
90	200	88	0
91	200	84	0
92	200	88	0
93	200	90	0
94	200	100	0
95	200	100	0
96	200	100	0
97	200	100	0
98	200	100	0
99	200	100	0
100	200	100	0
101	200	98	0
102	200	100	0
103	200	100	0
104	200	86	0
105	200	84	0
106	200	94	0
107	200	90	0
108	200	88	0
109	200	88	0
Swep	200	0	0
Chlorpropham	200	0	0
Barban	200	25	0
CEPC	200	0	0
Propham	200	0	0
Chlorbufam	200	0	0
Benomyl	200	0	100
Thiophanate-methyl	200	0	100
Carbendazim	200	0	100

Jak lze usoudit z výsledků uvedených v tabulce 3, vykazují N-fenylkarbamáty vzorce I podle vynálezu výtečnou preventivní účinnost na resistantní kmen, avšak nevykazují žádnou preventivní účinnost na testovaný citlivý kmen houby. Naproti tomu komerčně používané známé fungicidy, jako je Benomyl, Thiophanate-methyl a Carbendazim, vykazují pozoruhodnou účinnost proti citlivému kmeni houby, avšak nikoliv proti resistantnímu kmene. Ostatní testované sloučeniny s podobnou strukturou jako N-fenylkarbamáty vzorce I nevykazují žádny fungicidní účinek ani na kmen houby, který je resistantní, ani na kmen houby, který je citlivý.

Test 2

Preventivní účinnost na skvrnatičku řepné (*Cercospora beticola*) na cukrovce

Květináče o obsahu 90 ml se naplní písčitou půdou a do této půdy se zasejí semena cukrovky (varieta Detroit dark red). Rostliny se pěstují ve skleníku po dobu 20 dnů. Na vzešlé klíční rostliny se postříkem aplikuje testovaná sloučenina ve formě emulzního koncentrátu nebo smáčitelného prášku zředěného vodou v množství 10 ml na 1 květináč. Potom se klíční rostliny infikují postříkem suspenzí spor skvrnatičky řepné (*Cercospora beticola*), a to resistantního nebo citlivého kmene. Květináč se přikryje polyvinylchloridovou fólií k dosažení vysoké relativní vlhkosti a pokračuje se v pěstování rostlin ve skleníku po dobu 10 dnů. Stupeň poškození se určuje stejným způsobem jako v testu 1. Výsledky testu jsou uvedeny v tabulce 4.

Tabulka 4

sloučenina č.	koncentrace účinné látky (ppm)	preventivní účinnost při zamoření resistantním kmenem (%)	preventivní účinnost při zamoření citlivým kmenem (%)
2	200	100	0
11	200	100	0
12	200	100	0
13	200	100	0
14	200	100	0
15	200	100	0
16	200	100	0
17	200	100	0
21	200	100	0
24	200	100	0
25	200	100	0
27	200	100	0
28	200	100	0
30	200	100	0
31	200	100	0
32	200	100	0
35	200	100	0
36	200	100	0
38	200	100	0
39	200	100	0
40	200	100	0
42	200	88	0
43	200	94	0
46	200	100	0
50	200	97	0
52	200	100	0
53	200	100	0
56	200	100	0
60	200	100	0
61	200	100	0
62	200	100	0
68	200	100	0
73	200	100	0
75	200	100	0
76	200	100	0
80	200	100	0
81	200	100	0
83	200	100	0

sloučenina č.	koncentrace účinné látky (ppm)	preventivní účinnost při zamoření resistentním kmenem (%)	preventivní účinnost při zamoření citlivým kmenem (%)
86	200	100	0
87	200	100	0
88	200	100	0
94	200	100	0
95	200	100	0
96	200	97	0
98	200	100	0
99	200	100	0
100	200	100	0
101	200	100	0
102	200	100	0
Swep	200	0	0
Chlorpropham	200	0	0
Barban	200	34	0
CEPC	200	0	0
Propham	200	0	0
Chlorbufam	200	0	0
Benomyl	200	0	100
Thiophanate-methyl	200	0	100
Carbendazim	200	0	100

Jak vyplývá z výsledků uvedených v tabulce 4, vykazují N-fenylkarbamáty vzorce I podle vynálezu výtečnou preventivní účinnost na kmen, který je resistentní, avšak nevykazují preventivní účinek vůči testovanému citlivému kmeni. Naproti tomu komerčně upotřebitelné známé fungicidy jako Benomyl a Thiophanate-methyl vykazují pozoruhodný fungicidní účinek proti citlivému kmeni, avšak nikoliv proti resistentnímu kmeni houby. Ostatní testované sloučeniny, které jsou strukturně podobné N-fenylkarbamátům vzorce I, nevykazují fungicidní účinek ani proti citlivému ani proti resistentnímu kmeni houby.

Test 3

Preventivní účinnost na strupovitost hrušně (*Venturia nashicola*)

Květináče z plastické hmoty o obsahu 90

mililitrů se naplní písčitou půdou a do půdy se zasejí semena hrušně (varieta Chojuro). Kultivace probíhá ve skleníku po dobu 20 dnů. Na výsledné klíční rostliny se postříkem aplikuje testovaná sloučenina ve formě emulzního koncentrátu nebo smáčitelného prášku zředěného vodou v množství 10 ml na 1 květináč. Potom se klíční rostliny postříkem inokulují suspenzí spor strupovitosti hrušně (*Venturia nashicola*) a to jednak kmene resistentního a jednak citlivého kmene houby. Takto zamořené rostliny se po dobu 3 dnů ponechají při teplotě 20 °C a za vysoké relativní vlhkosti vzduchu a potom se ponechají 20 dnů při teplotě 20 °C za ozařování fluorescenční lampou. Stupeň poškození rostlin se stanovuje stejným způsobem jako v testu 1. Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v následující tabulce 5.

Tabulka 5

sloučenina č.	koncentrace účinné látky (ppm)	preventivní účinnost při zamoření resistentním kmenem (%)	preventivní účinnost při zamoření citlivým kmenem (%)
2	200	100	0
3	200	100	0
7	200	100	0
11	200	100	0
12	200	100	0
13	200	100	0
14	200	100	0
15	200	100	0
16	200	100	0
17	200	100	0
21	200	100	0
24	200	100	0
25	200	100	0
27	200	100	0
28	200	100	0
35	200	100	0
36	200	97	0
42	200	91	0
43	200	100	0
46	200	100	0
50	200	100	0
53	200	100	0
56	200	100	0
68	200	100	0
75	200	100	0
76	200	97	0
80	200	100	0
81	200	100	0
83	200	97	0
86	200	100	0
87	200	100	0
88	200	100	0
94	200	100	0
95	200	97	0
96	200	94	0
97	200	97	0
98	200	100	0
99	200	100	0
100	200	100	0
101	200	97	0
102	200	100	0
Benomyl	200	0	100
Thiophanate-methyl	200	0	100

Jak vyplývá z výsledků uvedených v tabulce 5, vykazují N-fenylkarbamáty vzorce I podle tohoto vynálezu výtečnou preventivní účinnost na kmen resistentní však nevykazují žádnou účinnost (rozumí se preventivní účinnost) na testovaný citlivý kmen houby. Naproti tomu komerčně upotřebitelné známé fungicidy, jako je Benomyl a Thiophanate-methyl, mají výrazný účinek na citlivý kmen, nemají však žádný účinek na resistentní kmen.

Test 4

Účinnost na cercosporiozu (*Cercospora arachidicola*) podzemnice olejné

Květináče z plastické hmoty o obsahu 90 mililitrů se naplní písčitou půdou a do půdy se zasejí semena podzemnice olejné (varieta Chiba hanryusei). Rostliny se nechají růst ve skleníku po dobu 14 dnů. Na klíční rostlinky se postříkem aplikuje testovaná sloučenina ve formě emulgovatelného kon-

centrátu nebo smáčitelného prášku zředěného vodou v množství 10 ml na 1 květináč. Potom se klíční rostliny zamoří postříkem suspenzí spor cerkosporiozy (*Cercospora arachidicola*) a to jednak kmene resistentního a jednak kmene citlivého. Zamořené

rostliny se zakryjí polyvinylchloridovou fólií ke zvýšení relativní vlhkosti vzduchu a rostliny se pěstují ve skleníku po dobu 10 dnů. Stupeň poškození rostlin se zjišťuje stejným způsobem jako v testu 1. Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v tabulce 6.

Tabulka 6

sloučenina č.	konzentrace účinné látky (ppm)	preventivní účinnost při zamoření resistentním kmenem (%)	preventivní účinnost při zamoření citlivým kmenem (%)
2	200	100	0
7	200	100	0
12	200	100	0
13	200	100	0
17	200	100	0
25	200	100	0
27	200	100	0
28	200	100	0
31	200	100	0
32	200	100	0
35	200	100	0
38	200	100	0
39	200	100	0
40	200	100	0
46	200	100	0
50	200	100	0
53	200	100	0
56	200	100	0
60	200	100	0
62	200	100	0
64	200	100	0
73	200	100	0
76	200	100	0
86	200	100	0
87	200	100	0
88	200	100	0
94	200	100	0
98	200	100	0
99	200	100	0
100	200	100	0
Benomyl	200	0	100
Thiophanate-methyl	200	0	100

Jak vyplývá z výsledků uvedených v tabulce 6, vykazují N-fenylkarbamáty vzorce I podle vynálezu výtečnou preventivní účinnost na resistentní kmen avšak nejsou účinné (preventivně účinné) proti testovanému citlivému kmeni houby. Naproti tomu mají komerčně upotřebitelné známé fungicidy, jako je Benomyl a Thiophanate-methyl, pozoruhodnou účinnost na citlivý kmen, avšak nejsou účinné proti resistentnímu kmeni.

Test 5

Preventivní účinnost na plíseň šedou (*Botrytis cinerea*) na okurkách

Květináče z plastické hmoty o obsahu 90 mililitrů se naplní písčitou půdou, do které

se zasejí semena okurky (varieta Sagami-hanjiro). Rostliny se pěstují 8 dnů ve skleníku až k získání klíčných rostlin s rozvinutými děložními lístky. Na získané klíční rostliny se postříkem aplikuje testovaná sloučenina ve formě emulzního koncentrátu nebo smáčitelného prášku zředěného vodou v množství 10 ml na 1 květináč. Po oschnutí postříkové vrstvy na vzduchu se klíční rostliny infikují kotoučky mycelia (o průměru 5 mm) plně šedé (*Botrytis cinerea*) resistentního nebo citlivého kmene přiložením na povrch listu. Po třídenní inkubaci rostlin za vysoké relativní vlhkosti vzduchu při teplotě 20 °C se hodnotí rozsah choroby. Stupeň poškození se určuje stejným způsobem jako v testu 1. Výsledky testu jsou uvedeny v tabulce 7.

Tabuľka 7

sloučenina č.	koncentrace účinné látky (ppm)	preventivní účinnost při zamoření resistentním kmenem (%)	preventivní účinnost při zamoření citlivým kmenem (%)
1	200	100	0
	50	94	0
2	200	100	0
	50	100	0
3	200	100	0
	50	94	0
4	500	98	0
5	200	100	0
6	200	91	0
7	200	100	0
	50	97	0
8	200	100	0
9	200	100	0
10	500	98	0
11	200	97	0
12	200	100	0
	50	97	0
13	200	100	0
	50	100	0
	12,5	100	0
14	200	100	0
	50	100	0
15	200	100	0
	50	100	0
	12,5	100	0
16	200	100	0
	50	100	0
17	200	100	0
	50	100	0
18	200	97	0
19	200	100	0
20	200	100	0
21	200	100	0
	50	100	0
22	200	97	0
23	500	96	0
24	200	100	0
25	200	100	0
	50	100	0
	12,5	100	0
26	200	100	0
27	200	100	0
	50	100	0
28	200	100	0
	50	100	0
	12,5	94	0
29	200	100	0
	50	100	0
30	200	100	0
	50	100	0
31	200	100	0
	50	100	0
32	200	100	0
	50	100	0
33	500	86	0
34	200	100	0
35	200	100	0
	50	100	0

2 3 6 6 8 8

sloučenina č.	konzentrace účinné látky (ppm)	preventivní účinnost při zamoření resistentním kmenem (%)	preventivní účinnost při zamoření citlivým kmenem (%)
36	200	100	0
37	200	100	0
38	200	100	0
	50	100	0
39	200	100	0
	50	100	0
40	200	100	0
	50	100	0
41	200	94	0
42	500	82	0
43	200	100	0
	50	100	0
	12,5	94	0
44	200	100	0
45	200	91	0
46	200	100	0
	50	100	0
47	200	100	0
48	200	100	0
49	200	100	0
50	200	100	0
	50	100	0
51	200	100	0
	50	100	0
52	200	100	0
	50	100	0
53	200	100	0
	50	100	0
54	200	95	0
55	500	97	0
56	200	100	0
	50	100	0
57	200	97	0
58	200	97	0
59	200	100	0
60	200	100	0
61	200	100	0
	50	100	0
62	200	100	0
	50	100	0
63	200	100	0
	50	100	0
64	200	100	0
	50	100	0
65	500	87	0
66	200	100	0
67	200	100	0
68	200	100	0
69	500	95	0
70	200	100	0
71	200	97	0
72	200	97	0
73	200	97	0
74	200	100	0
75	200	100	0
76	200	100	0
77	500	97	0
78	200	100	0
79	200	100	0
80	200	100	0
81	200	100	0
82	200	100	0

sloučenina č.	konzentrace účinné látky (ppm)	preventivní účinnost při zamoření resistentním kmenem (%)	preventivní účinnost při zamoření citlivým kmenem (%)
83	200	100	0
	50	92	0
84	200	100	0
85	200	97	0
86	200	100	0
	50	100	0
	12,5	97	0
87	200	100	0
	50	97	0
	12,5	86	0
88	200	100	0
	50	100	0
	12,5	88	0
89	200	94	0
90	200	88	0
91	200	92	0
92	200	92	0
93	200	94	0
94	200	100	0
	50	97	0
	12,5	94	0
95	200	100	0
	50	97	0
96	200	100	0
	50	94	0
97	200	100	0
	50	94	0
98	200	100	0
	50	100	0
	12,5	97	0
99	200	100	0
	50	97	0
	12,5	94	0
100	200	100	0
	50	97	0
	12,5	97	0
101	200	100	0
	50	94	0
102	200	100	0
	50	97	0
103	200	100	0
	50	94	0
104	200	97	0
105	200	97	0
106	200	100	0
107	200	100	0
108	200	100	0
109	200	97	0
Benomyl	200	0	100
Thiophanate-methyl	200	0	100

Jak vyplývá z výsledků uvedených v tabulce 7, mají N-fenylkarbamáty vzorce I podle vynálezu výtečnou preventivní účinnost na resistentní kmen, avšak jsou neúčinné na testovaný citlivý kmen houby. Na proti tomu komerčně upotřebitelné známé fungicidy jako je Benomyl a Thiophanate-methyl vykazují pozoruhodný fungicidní účinek na citlivý kmen, avšak jsou neúčinné na resistentní kmen.

Test 6

Preventivní účinnost na *Mycosphaerella melonis* na okurkách

Květináče z plastické hmoty o objemu 90 mililitrů se naplní písčitou půdou, do které se zasejí semena okurky (varieta Sagami-hanjiro). Kultivace se provádí ve skleníku po dobu 8 dnů až k získání klíčních rostlin okurek s vyvinutými děložními lis-

ty. Na výsledné klíční rostliny se postříkem aplikuje testovaná sloučenina ve formě emulzního koncentrátu nebo smáčitelného prášku zředěného vodou v množství 10 ml na 1 květináč. Po oschnutí postříkové vrstvy na vzduchu se klíční rostliny infikují kotoučky mycelia (o průměru 5 mm) houby *Mycosphaerella melonis* resistentního

nebo citlivého kmene přiložením na povrch listu. Potom se rostliny takto infikované inkubují po dobu 4 dnů za vysoké vlhkosti při teplotě 25 °C, načež se hodnotí rozsah choroby. Stupeň poškození se zjišťuje týmž způsobem jako v testu 1. Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v tabulce 8.

Tabulka 8

sloučenina č.	koncentrace účinné látky (ppm)	preventivní účinnost při zamoření resistentním kmenem (%)	preventivní účinnost při zamoření citlivým kmenem (%)
3	200	100	0
7	200	100	0
12	200	100	0
13	200	100	0
14	200	100	0
16	200	100	0
28	200	100	0
36	200	100	0
46	200	100	0
48	200	100	0
49	200	100	0
53	200	100	0
56	200	100	0
61	200	100	0
63	200	100	0
74	200	100	0
76	200	100	0
86	200	100	0
87	200	100	0
88	200	100	0
94	200	100	0
98	200	100	0
99	200	100	0
100	200	100	0
Benomyl	200	0	100
Thiophanate-methyl	200	0	100

Jak vyplývá z výsledků uvedených v tabulce 8, mají N-fenylkarbamáty vzorce I podle vynálezu výtečnou účinnost (preventivní účinnost) na resistentní kmen avšak nejsou účinné (preventivní účinné) proti testovanému citlivému kmeni houby. Naopak, komerčně upotřebitelné známé fungicidy jako Benomyl a Thiophanate-methyl mají pozoruhodný fungicidní účinek na citlivý kmen, avšak nejsou účinné proti resistentnímu kmeni houby.

Test 7

Preventivní účinnost na *Penicillium italicum* na pomerančích

Pomerančové plody (varieta Unshu) se umyjí vodou a osuší se na vzduchu. Potom se plody ponoří po dobu 1 minuty do roztoku testované sloučeniny připraveného zředěním emulzního koncentrátu obsahujícího testovanou sloučeninou vodou. Po o-

schnutí na vzduchu se pomerančové plody infikují postříkem suspenzí spor houby *Penicillium italicum* a to resistentního nebo citlivého kmene a umístí se na 14 dnů do místnosti s vysokou vlhkostí. Stupeň poškození se zjišťuje následujícím způsobem:

Testované plody se měří a zjistí se infikovaná plocha v %, která se klasifikuje příslušným indexem 0, 1, 2, 3, 4, 5:

index	infikovaná plocha v %
0	bez infekce
1	menší než 20 %
2	menší než 40 %
3	menší než 60 %
4	menší než 80 %
5	větší než 80 %

Výpočet stupně poškození a preventivní účinnosti se provádí jako v testu 1.

Výsledky testu jsou uvedeny v tabulce 9.

Tabulka 9

sloučenina č.	konzentrace účinné látky (ppm)	preventivní účinnost při zamoření resistentním kmenem (%)	preventivní účinnost při zamoření citlivým kmenem (%)
2	200	100	0
5	200	100	0
9	200	100	0
11	200	100	0
13	200	100	0
21	200	100	0
28	200	97	0
46	200	100	0
50	200	100	0
53	200	100	0
56	200	100	0
61	200	100	0
62	200	100	0
63	200	100	0
64	200	100	0
67	200	100	0
70	200	100	0
73	200	100	0
74	200	100	0
75	200	100	0
76	200	100	0
86	200	100	0
87	200	100	0
88	200	100	0
94	200	100	0
98	200	100	0
99	200	100	0
100	200	100	0
Benomyl	200	0	100
Thiophanate-methyl	200	0	100
Thiabendazole	200	0	100

Jak vyplývá z výsledků uvedených v tabulce 9, mají N-fenylkarbamáty vzorce I podle vynálezu výtečnou preventivní účinnost na resistentní kmen avšak nejsou vůbec preventivní účinné na testovaný citlivý kmen houby. Naproti tomu komerčně upotřebitelné známé fungicidy jako Benomyl, Thiophanate-methyl a Thiabendazole mají pozoruhodný fungicidní účinek na citlivý kmen, jsou však neúčinné na resistentní kmen.

Test 8

Preventivní účinnost na padlí Sphaerotheca fuliginea na okurkách

Květináče z plastické hmoty o obsahu 90

mililitrů se naplní písčitou půdou, do které se zasejí semena okurky (varieta Sagami-hanjiro). Kultivace se provádí ve skleníku po dobu 8 dnů. Když klíční rostlinky rozvinou děložní listy aplikuje se postříkem testovaná sloučenina či testované sloučeniny ve formě emulzního koncentrátu nebo smáčitelného prášku zředěného vodou v množství 10 ml na 1 květináč. Potom se klíční rostlinky infikují postříkem suspenzí směsi spor resistentního a citlivého kmene houby Sphaeroteca fuliginea. Rostlinky se potom dále kultivují ve skleníku. 10 dnů poté se hodnotí stupeň zamoření rostlin. Stupeň poškození se zjišťuje stejným způsobem jako v testu 1. Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v tabulce 10.

Tabulka 10

sloučenina č.	konzentrace účinné látky (ppm)	preventivní účinnost (%)
13	100	34
13	20	0
15	100	28
15	20	0
28	100	44
28	20	0
43	100	36
43	20	0
86	100	44
86	20	0
88	100	28
88	20	0
94	100	32
94	20	0
98	100	28
98	20	0
99	100	28
99	20	0
100	100	36
100	20	0

Test 9

Preventivní účinek na plíseň šedou (*Botrytis cinerea*) na rajčeti

Květináče z plastické hmoty o obsahu 90 mililitrů se naplní písčitou půdou a do této půdy se zasejí semena rajčete (varieta Fukuji č. 2). Rostliny se nechají růst ve skleníku po dobu 4 týdnů. Na vzešlé klíční rostlinky se ve stadiu 4 listů postříkem aplikuje testovaná sloučenina či testované

sloučeniny ve formě emulzního koncentrátu nebo smáčitelného prášku zředěného vodou v množství 10 ml na 1 květináč. Rostliny se potom postříkem infikují suspenzí směsi spor resistentního a citlivého kmene houby *Botrytis cinerea* a na dobu 5 dnů se umístí do místnosti s vysokou vlhkostí. Stupeň poškození se zjišťuje stejným způsobem jako byl popsán v testu 1.

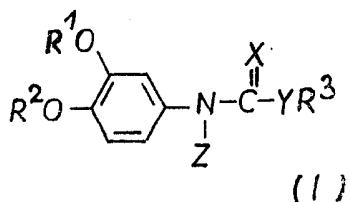
Výsledky testu jsou uvedeny v následující tabulce 11.

Tabulka 11

sloučenina č.	konzentrace účinné látky (ppm)	preventivní účinnost (%)
13	100	44
13	20	0
25	100	27
25	20	0
28	100	38
28	20	0
43	100	38
43	20	0
86	100	42
86	20	0
88	100	42
88	20	0
94	100	42
94	20	0
98	100	40
98	20	0
99	100	44
99	20	0
100	100	38
100	20	0

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Fungicidní prostředek, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jeden N-fenylkarbamát obecného vzorce I



němž

R^1 a R^2 mají stejný nebo vzájemně rozdílný význam, a znamenají alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, allylovou skupinu, propargylovou skupinu nebo halogenalkylovou skupinu s 1 až 2 atomy uhlíku,

R^3 znamená alkylovou skupinu s 1 až 8 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 3 až 8 atomy uhlíku, alkinylovou skupinu se 3 až 8 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinu se 4 atomy uhlíku, halogenalkenylovou skupinu se 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu se 4 atomy uhlíku, fenethylovou skupinu, furylethylmethylovou skupinu, halogenalkylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku, kyanethylovou skupinu, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části a se 2 až 3 atomy uhlíku v alkylové části, allyloxyethylovou skupinu, halogenethoxyethylovou skupinu, methoxyhalogenalkylovou skupinu se 3 atomy uhlíku v alkylové části, benzyloxyethylovou skupinu, cykloalkylalkylovou skupinu se 3 až 5 atomy uhlíku v cykloalkylové části a s 1 až 2 atomy uhlíku v alkylové části nebo tetrahydrofuranylovou skupinu,

X a Y jsou stejné nebo vzájemně rozdílné a znamenají kyslík nebo síru, a

Z znamená vodík, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, allylovou skupinu, ethoxycarbonylmethylovou skupinu, alkanoylovou skupinu se 2 až 5 atomy uhlíku, cyklopropankarbonylovou skupinu, benzoylovou skupinu, halogenbenzoylovou skupinu, methylenbenzoylovou skupinu nebo methansulfonylovou skupinu, spolu s alespoň jedním inertním nosičem nebo ředitlem.

2. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jeden N-fenylkarbamát obecného vzorce I, v němž

R^1 a R^2 znamenají každý ethoxyskupinu,

R^3 znamená alkylovou skupinu s 1 až 8 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 3 až 8 atomy uhlíku, alkinylovou skupinu se 3 až 8 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupi-

nu se 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu se 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části a se 2 až 3 atomy uhlíku v alkylové části nebo cykloalkylalkylovou skupinu se 3 až 5 atomy uhlíku v cykloalkylové části a s 1 až 2 atomy uhlíku v alkylové části,

X znamená kyslík,

Y znamená kyslík a

Z znamená vodík.

3. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jeden N-fenylkarbamát obecného vzorce I, v němž

R^1 a R^2 znamená každý alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, propargylovou skupinu nebo halogenalkylovou skupinu s 1 až 2 atomy uhlíku,

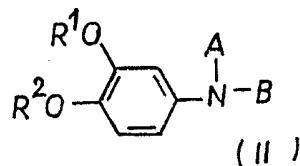
R^3 znamená alkylovou skupinu s 1 až 8 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 3 až 8 atomy uhlíku, alkinylovou skupinu se 3 až 8 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinu se 4 atomy uhlíku, halogenalkenylovou skupinu se 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu se 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku, kyanethylovou skupinu, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části a se 2 až 3 atomy uhlíku v alkylové části, allyloxyethylovou skupinu, halogenethoxyethylovou skupinu, methoxyhalogenalkylovou skupinu se 3 atomy uhlíku v alkylové části, benzyloxyethylovou skupinu nebo cykloalkylalkylovou skupinu se 3 až 5 atomy uhlíku v cykloalkylové části a s 1 až 2 atomy uhlíku v alkylové části,

X znamená kyslík,

Y znamená kyslík a

Z znamená vodík.

4. Způsob výroby účinné složky podle bodu 1, obecného vzorce I, vyznačující se tím, že se na derivát anilinu obecného vzorce II



v němž

A znamená vodík a

B znamená skupinu Z nebo skupinu

$-\text{C}(=\text{X})-\text{YR}^3$ nebo

A a B znamenají společně skupinu

$-\text{C}=\text{X}$, a

R¹, R², R³, X, Y a Z mají shora uvedené významy,
působí odpovídající sloučeninou obecného vzorce III

E—D

(III),

v němž
D znamená skupinu —C(=X)—YR³, —YR³
nebo —Z a
E znamená vodík nebo halogen, a
R³, X, Y a Z mají shora uvedené významy.