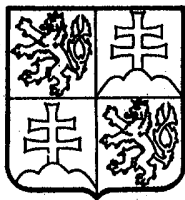


ČESKÁ A SLOVENSKÁ
FEDERATIVNÍ
REPUBLIKA
(19)



FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

ZVEŘEJNĚNÁ PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

(12)

(21) 02325-91.N

(13) A3

5(51) C 07 C 235/56,
A 01 N 37/18

(22) 24.07.91

(32) 27.07.90

(31) 90/16581

(33) GB

(40) 19.02.92

(71) IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC, London, GB

(72) Crowley Patrick Jelf, Bracknell, GB
Lawson Kevin Robert, Bracknell, GB
Spence Rosamund Alison, Bracknell, GB
Glen Alasdair Thomas, Macclesfield, GB

(54) Fungicidní sloučeniny, způsob jejich přípravy a
fungicidní prostředky

(57) Fungicidní sloučeniny obecného vzorce I, kde D' a E jsou nezávisle na sobě H nebo F, X a Y jsou O nebo S, R¹ až R⁴ mají různé specifické významy, A a B jsou nezávisle na sobě H, I, nitroskupina, kyanoskupina, C₁₋₄alkoxykarbonyl, C₁₋₄alkoxy(C₁₋₄)alkyl, C₁₋₄alkylthio(C₁₋₄)alkyl, formyl, C₁₋₄alkylthioskupina, halogen(C₁₋₄)alkylthioskupina, halogen(C₁₋₄)alkoxysskupina, C₁₋₄alkylkarbonyl, -CR⁵=NOR⁶ (kde R⁵ a R⁶ jsou nezávisle na sobě H nebo C₁₋₄-alkyl), C₂₋₄alkenyl nebo C₂₋₄alkinyl, přičemž A a B nejsou současně oba H. Dále jsou popsány způsoby přípravy těchto sloučenin, fungicidní prostředky obsahující tyto sloučeniny a způsob potírání hub za použití těchto sloučenin.

Fungicidní sloučeniny, způsob jejich přípravy a fungicidní prostředky

Oblast techniky

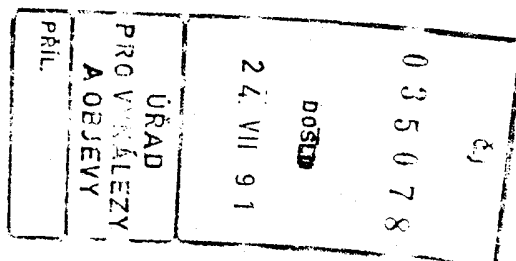
Vynález se týká nových fungicidních acylamino-benzamidů, způsobů jejich přípravy, fungicidních prostředků obsahujících tyto acylaminobenzamidy jako účinné látky a způsobů používání těchto sloučenin a prostředků k potírání hub, zejména k potírání houbových infekcí rostlin.

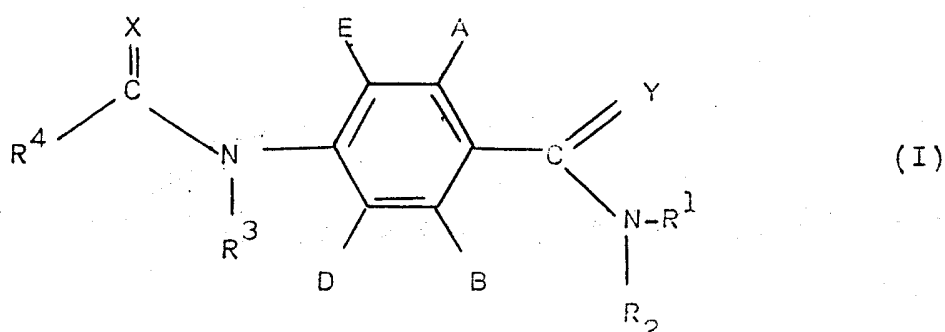
Dosavadní stav techniky

Jsou známy britská přihláška č. 42 454/77, z níž například nárokuje prioritu US patent č. 4 282 218, a evropská přihláška EP-A-0127990. Prvá z těchto přihlášek popisuje acylanilidy, které mají antis-drogenní vlastnosti a druhá popisuje deriváty anilinu, které vykazují fungicidní vlastnosti.

Podstata vynálezu

Podstatou předloženého vynálezu jsou sloučeniny obecného vzorce I





ve kterém

A a B jsou nezávisle na sobě atom vodíku, atom jodu, nitroskupina, kyanoskupina, alkoxykarbonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxyly, alkoxyalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxyly a s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylu, alkylthioalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylech, formylová skupina, alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylkarbonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylu, skupina $-CR^5=NOR^6$, kde R^5 a R^6 jsou nezávisle na sobě atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, dále znamenají A a B alkenylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku nebo alkinylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku, přičemž A a B nejsou současně atomy vodíku,

D a E jsou nezávisle na sobě atom vodíku nebo atom fluoru,
 R^1 je atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,
 R^2 je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo popřípadě substituovaná fenylová skupina, nebo

R^1 a R^2 spolu dohromady s atomem dusíku, ke kterému jsou připojeny, tvoří morfolinový, piperidinový, pyrrolidinový nebo azetidinový kruh, který je popřípadě

substituován alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku,

R^3 je atom vodíku,

R^4 je trichlormethyl, alkylová skupina se 2 až 8 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována atomem halogenu, alkoxylovou skupinou s 1 až 8 atomy uhlíku nebo skupinou $R'S(O)_n$, kde R' je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkenylová skupina se 2 až 4 atomy uhlíku nebo alkinyllová skupina se 2 až 4 atomy uhlíku a n je 0, 1 nebo 2, dále je R^4 cyklopropylová skupina, která je popřípadě substituována atomem halogenu nebo alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, dále alkenylová skupina se 2 až 8 atomy uhlíku, alkinyllová skupina se 2 až 8 atomy uhlíku nebo alkoxylová skupina se 2 až 8 atomy uhlíku, přičemž každá z těchto skupin je popřípadě substituována atomem halogenu, dále mono- nebo dialkylaminoskupina s 1 až 4 atomy uhlíku v každém z alkylů, nebo skupina $R''ON=C(CN)$, kde R'' je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

R^3 a R^4 spolu dohromady se skupinou $C(O)N$, ke které jsou připojeny, tvoří azetidin-2-onový kruh, který je popřípadě substituován atomem halogenu nebo alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, a

X a Y jsou nezávisle na sobě kyslík nebo síra.

Alkylové skupiny a alkylové části skupin obsahujících alkylové části mohou být ve formě přímých nebo rozvětvených řetězců. Příklady jsou methyl, ethyl, propyl (n- a iso-propyl), butyl (n-, sek., iso- a terc.butyl), 1,1-dimethylpropyl a 1,1-dimethylbutyl. Alkenylové a alkinyllové skupiny mohou být také ve formě přímých nebo rozvětvených řetězců. Příklady jsou 1,1-dimethyl-3-butenyl a 1,1-dimethyl-2-propinyl.

Výhodnou alkylovou skupinou pro substituent R^4 je skupina $R(CH_3)_2C$, kde R je atom halogenu, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, a zejména skupina $F(CH_3)_2C$. Další výhodnou skupinou pro substituent R^4 je skupina $F(R^8)(R^9)C$, kde R^8 a R^9 jsou nezávisle na sobě atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku.

Atomem halogenu se rozumí atom fluoru, chloru nebo bromu.

Případnými substituenty na fenylu jsou: atom halogenu, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku (například methyl), alkoxylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku (například methoxyl), alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku (například methylthioskupina), trifluormethyl, trifluormethoxyskupina, nitroskupina, kyanoskupina, alkoxykarbonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxyly, aminoskupina a mono- a dialkylaminoskupina s 1 až 4 atomy uhlíku v každém z alkylů.

Jednu skupinu sloučenin podle předloženého vynálezu tvoří sloučeniny obecného vzorce I, kde A je atom jodu, kyanoskupina, nitroskupina, alkoxykarbonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxyly, alkylkarbonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylu, alkoxyalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxyly a 1 až 4 atomy uhlíku v alkylu, alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, formylová skupina, alkylthioalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v každém z alkylů, nebo skupina $-CH=NOR^6$, kde R^6 je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; R^1 a R^2 jsou alkylové skupiny (zejména methyl nebo ethyl); R^3 , B , D a E jsou atomy vodíku; R^4 je alkylová skupina se 2 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovaná atomem halogenu nebo alkoxylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku; a X a Y jsou oba atomy kyslíku.

Předložený vynález je blíže ilustrován sloučeninami uvedenými v následující tabulce I, kde jsou shrnuty sloučeniny obecného vzorce I, kde R^1 , R^2 , R^4 , A a B mají významy uvedené v této následující tabulce a R^3 , D a E jsou atomy vodíku a X a Y jsou atomy kyslíku.

T a b u l k a I

slouč. číslo	R^1	R^2	R^4	A	B	teplota tání (°C)
1	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	I	H	228,5-230,5
2	CH ₃	CH ₃	CH ₃ CH ₂ (CH ₃) ₂ C	I	H	
3	CH ₃	CH ₃	Cl(CH ₃) ₂ C	I	H	
4	CH ₃	CH ₃	Br(CH ₃) ₂ C	I	H	
5	CH ₃	CH ₃	F(CH ₃) ₂ C	I	H	165,5-168
6	CH ₃	CH ₃	CH ₃ O(CH ₃) ₂ C	I	H	
7	CH ₃	CH ₃ CH ₂	(CH ₃) ₃ C	I	H	
8	CH ₃	CH ₃ CH ₂	CH ₃ CH ₂ (CH ₃) ₂ C	I	H	
9	CH ₃	CH ₃ CH ₂	Cl(CH ₃) ₂ C	I	H	
10	CH ₃	CH ₃ CH ₂	Br(CH ₃) ₂ C	I	H	
11	CH ₃	CH ₃ CH ₂	F(CH ₃) ₂ C	I	H	
12	CH ₃	CH ₃ CH ₂	CH ₃ O(CH ₃) ₂ C	I	H	
13	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	CN	H	145-148,5
14	CH ₃	CH ₃	F(CH ₃) ₂ C	CN	H	
15	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	NO ₂	H	189-194
16	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	COOCH ₃	H	260(rozk1.)
17	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	COCH ₃	H	
18	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	CH ₂ OCH ₃	H	
19	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	SCH ₃	H	*
20	CH ₃	CH ₃	F(CH ₃) ₂ C	COOCH ₃	H	

slouč. číslo	R ¹	R ²	R ⁴	A	B	teplota tání (°C)
21	CH ₃	CH ₃	F(CH ₃) ₂ C	COCH ₃	H	
22	CH ₃	CH ₃	F(CH ₃) ₂ C	CH ₂ OCH ₃	H	
23	CH ₃	CH ₃	F(CH ₃) ₂ C	SCH ₃	H	*
24	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	CHO	H	
25	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	CH ₂ SCH ₃	H	
26	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	CH=NOCH ₃	H	
27	CH ₃	CH ₃	F(CH ₃) ₂ C	SCF ₃	H	*
28	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	COOCH ₂ CH ₃	H	208-209
29	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	CHO	H	186-187
30	CH ₃	CH ₃	F(CH ₃ CH ₂) ₂ C	I	H	143-145
31	CH ₃	CH ₃	F(CH ₃)(CH ₃ CH ₂)C	I	H	146-147
32	CH ₃	CH ₃	F(FCH ₂)(CH ₃)C	I	H	140-144
33	CH ₃	CH ₃	F(CH ₃) ₂ C	-C≡CH	H	110(rozkł.)
34	CH ₃	CH ₃	F(CH ₃) ₂ C	-HC=CH ₂	H	164-165
35	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	-C≡CH	H	130(rozkł.)

* sloučenina číslo 19

¹H NMR (270 MHz, CDCl₃) δ 1,33 (9H, s), 2,50 (3H, s), 2,85 (3H, s), 3,10 (3H, s), 7,13 (2H, d), 7,40 (1H, s), 7,74 (1H, s) ppm.

* sloučenina číslo 23

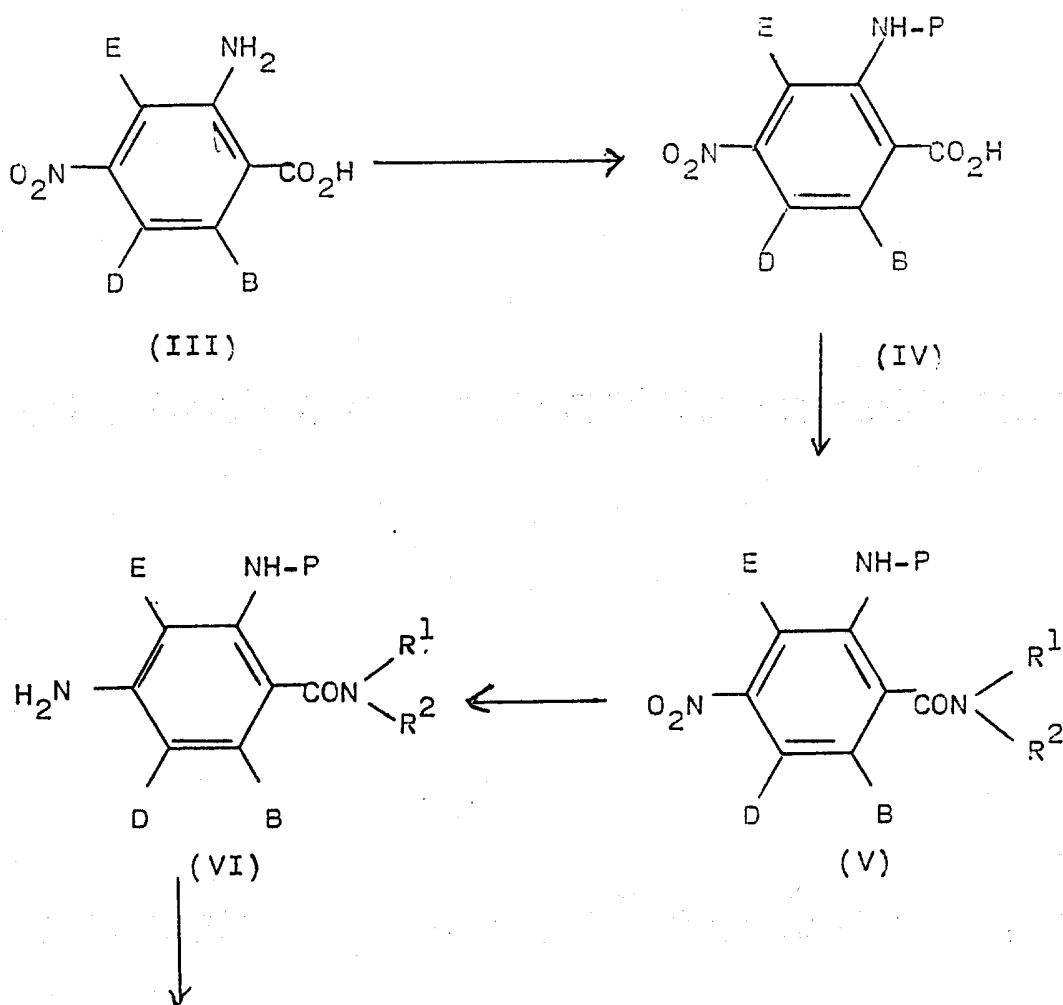
¹H NMR (270 MHz, CDCl₃) δ 1,68 (6H, d), 2,50 (3H, s), 2,85 (3H, s), 3,12 (3H, s), 7,18 (1H, d), 7,25 (1H, dd), 7,72 (1H, d), 8,15 (1H, široký s) ppm.

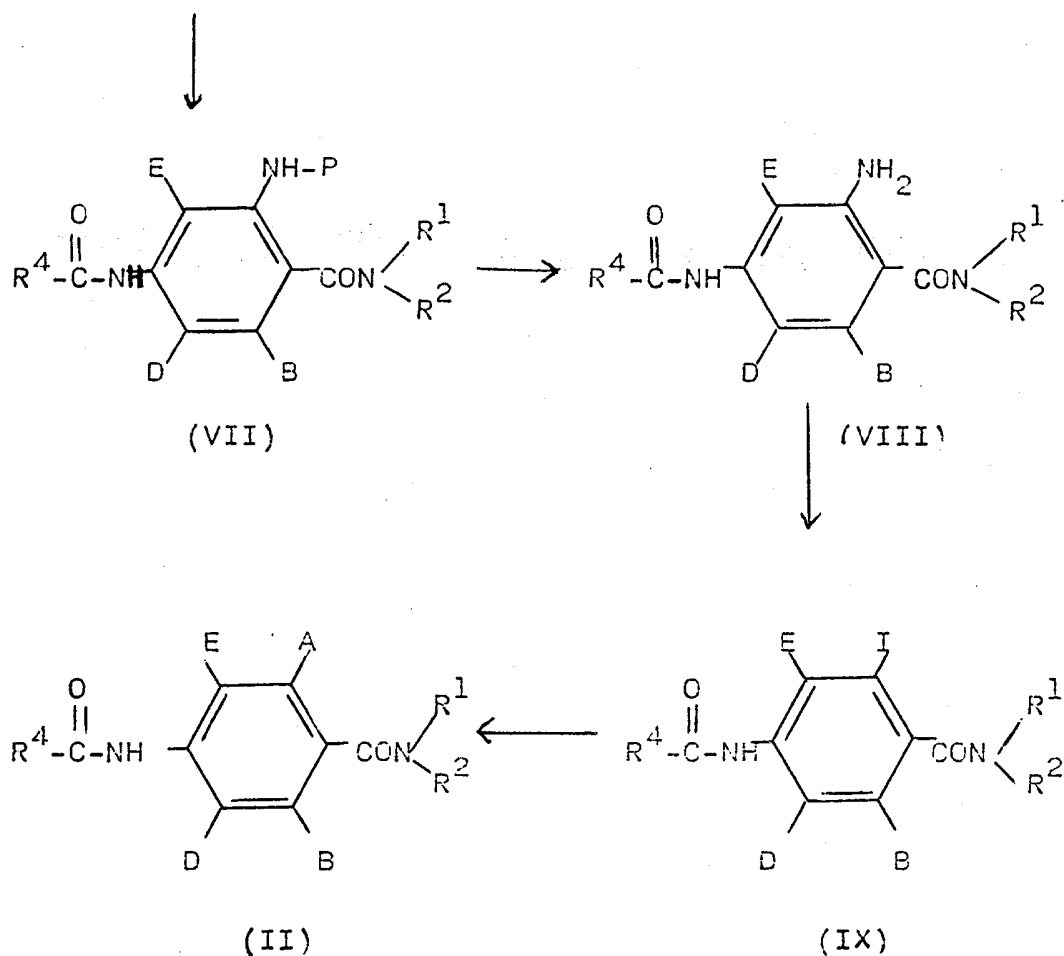
* sloučenina číslo 27

^1H NMR (270 MHz, CDCl_3) δ 1,68 (6H, d), 2,87 (3H, s), 3,15 (3H, s), 7,35 (1H, d), 7,85 (1H, dd), 7,95 (1H, s), 8,22 (1H, široký s) ppm.

Sloučeniny podle předloženého vynálezu lze například připravit postupy naznačenými ve schemech 1 a 2. V obou těchto schemech mají R^1 , R^2 , R^4 , A, B, D a E výše uvedený význam.

S c h e m a 1





Podle schematu 1 lze sloučeniny výše uvedeného vzorce II, kde A je například kyanoskupina nebo alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, připravit reakcí sloučeniny obsahující jod výše uvedeného vzorce IX se solí přechodového kovu, například s kyanidem měďným nebo methanthiolátem měďným, ve vhodném rozpouštědle, jako je N,N-dimethylformamid nebo dimethylsulfoxid.

Sloučeniny obsahující jod výše uvedeného vzorce IX lze připravit z anilinů výše uvedeného vzorce VIII reakcí s kyselinou dusitou (uvolněnou například z dusitanu sodného a kyseliny sírové) a zdroje jodu, jako je jodid draselný.

Aniliny výše uvedeného vzorce VIII lze připravit ze sloučenin výše uvedeného vzorce VII, kde P je

chránicí skupina. Například, když P je trifluoracetylová skupina, lze ji odstranit reakcí sloučeniny výše uvedeného vzorce VII s basí v rozpouštědle obsahujícím hydroxylové skupiny, jako je uhličitán draselný v methanolu.

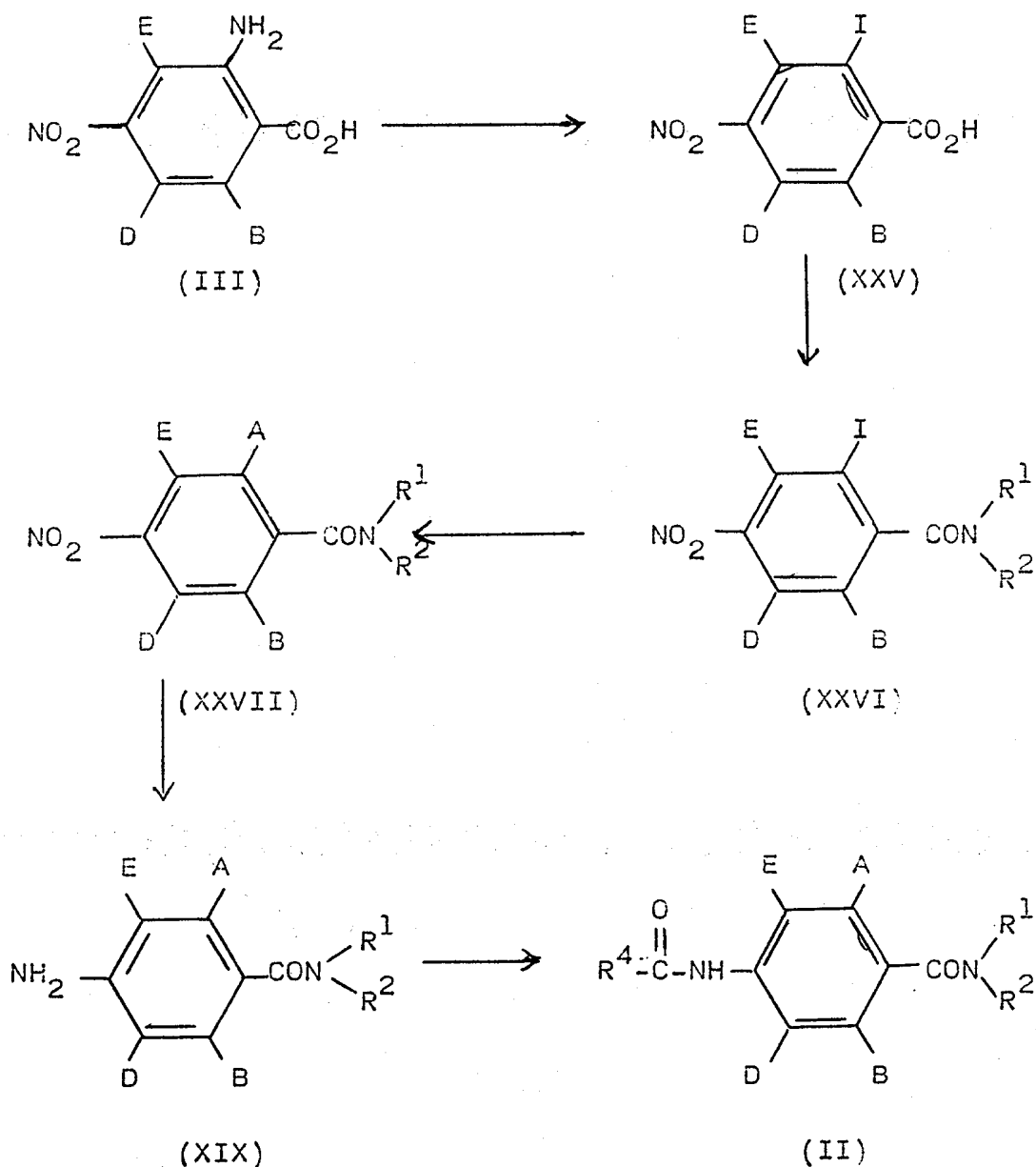
Sloučeniny výše uvedeného vzorce VII lze připravit z anilinů výše uvedeného vzorce VI reakcí s chloridem kyseliny vzorce R^4COCl ve vhodném organickém rozpouštědle, jako je methylenchlorid, v přítomnosti base, jako je terciární amin (například triethylamin) nebo uhličitán nebo hydroxid alkalického kovu (například uhličitán sodný nebo hydroxid sodný).

Aniliny výše uvedeného vzorce VI lze připravit z nitrosloučenin výše uvedeného vzorce V standardními postupy, jako je hydrogenace na katalysátoru ze vzácného kovu (například palladium na uhlí) ve vhodném rozpouštědle (například v ethylacetátu) nebo železa nebo na chloridu cínatém v kyselině chlorovodíkové.

Nitroamidy výše uvedeného vzorce V lze připravit z nitrokyselin výše uvedeného vzorce IV reakcí nejprve se standardním reakčním činidlem, jako je thionylchlorid nebo oxalylchlorid, přičemž vznikne chlorid kyseliny, který se potom nechá reagovat s aminem vzorce R^1R^2NH ve vhodném rozpouštědle, jako je methylenchlorid, v přítomnosti base, jako je terciární amin (například triethylamin), nebo uhličitán nebo hydroxid alkalického kovu (například uhličitán draselný nebo hydroxid sodný).

Nitrokyseliny výše uvedeného vzorce IV lze připravit ze sloučenin výše uvedeného vzorce III chráněním aminoskupiny chránicí skupinou P, jako je trifluoracetyl, a to reakcí s anhydridem kyseliny trifluoroctové.

S c h e m a 2



Podle schematu 2 lze sloučeniny výše uvedeného vzorce II připravit z aminoamidů výše uvedeného vzorce XIX reakcí s chloridem kyseliny vzorce R^4COCl ve vhodném organickém rozpouštědle, jako je dichlormethan, v přítomnosti

base, jako je terciární amin (například triethylamin) nebo uhličitán nebo hydroxid alkalického kovu (například uhličitán sodný nebo hydroxid sodný).

Aminoamidy výše uvedeného vzorce XIX lze připravit z nitrosloučenin výše uvedeného vzorce XXVII redukcí za použití běžných postupů, jako je hydrogenace na katalysátoru ze vzácného kovu (například palladium na uhlí) ve vhodném rozpouštědle (například ethylacetátu) nebo železo, nebo na chloridu cínatém v kyselině chlorovodíkové.

Postup popsaný ve schematu 2 je obzvláště vhodný pro přípravu sloučenin výše uvedeného vzorce II, kde A je atom jodu, 1-alkenyl se 2 až 4 atomy uhlíku nebo 1-alkinyl se 2 až 4 atomy uhlíku. V případě, že A je 1-alkenyl se 2 až 4 atomy uhlíku nebo 1-alkinyl se 2 až 4 atomy uhlíku, nitrosloučeniny výše uvedeného vzorce XXVII lze připravit z jodidů výše uvedeného vzorce XXVI reakcí s alkinem se 2 až 4 atomy uhlíku nebo s 1-tri-n-butylstannylalkenem se 2 až 4 atomy uhlíku ve vhodném rozpouštědle (například N,N-dimethylformamid nebo acetonitril) v přítomnosti katalysátoru (například bis(trifenylfosfin)palladium-II-dichlorid), popřípadě v přítomnosti soli jednovalné mědi (například jodid měďný). Jestliže A je ethinyl se 2 až 4 atomy uhlíku, použitý alkin se 2 až 4 atomy uhlíku je trimethylsilylethin, a trimethylsilylová skupina se odstraní v následujícím stupni reakcí s uhličitánem draselným ve vhodném rozpouštědle, jako je methanol. V případě, že A je atom jodu, jodidy výše uvedeného vzorce XXVI se použijí přímo jako nitrosloučeniny výše uvedeného vzorce XXVII.

Jodidy výše uvedeného vzorce XXVI lze připravit z nitrokyselin výše uvedeného vzorce XXV reakcí nejprve se standardním reakčním činidlem, jako je thionylchlorid nebo oxalylchlorid, za vzniku chloridu kyseliny, který se potom nechá reagovat s aminem vzorce R^1R^2NH ve vhodném rozpouštědle, jako je dichlormethan, v pří-

tomnosti base, jako je terciární amin (například triethylamin), nebo uhličitan nebo hydroxid alkalického kovu (například uhličitan draselný nebo hydroxid sodný).

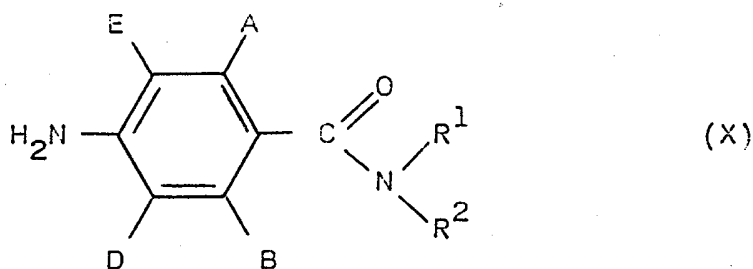
Nitrokyseliny výše uvedeného vzorce XXV lze připravit z anilinů výše uvedeného vzorce III reakcí s kyselinou dusitou (uvolněnou například z dusitanu sodného a kyseliny sírové) a ze zdrojem jodu, jako je jodid draselný.

Sloučeniny podle předloženého vynálezu lze také připravit podle postupů popsaných v evropské přihlášce EP-A-0381330 a v britských přihláškách č. 9016577,0, 9016580,4 a 9016582,6 a v přihláškách, které z nich nárokuje prioritu, přičemž obsah těchto přihlášek je zde uváděn jako odkaz.

Dalším předmětem předloženého vynálezu jsou zde popsány způsoby pro přípravu sloučenin podle vynálezu, včetně způsobu popsaného v evropské přihlášce EP-A-0381330, je-li tento způsob používán pro přípravu sloučenin podle vynálezu. Tímto způsobem se připraví sloučeniny podle vynálezu :

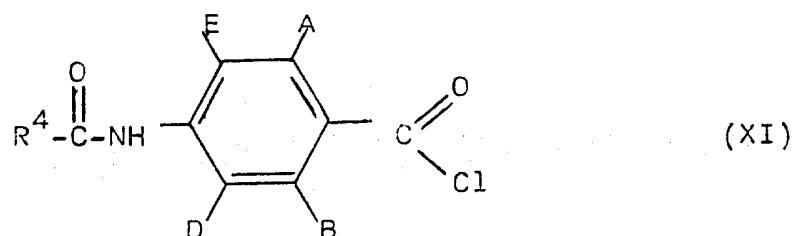
a) kde X a Y jsou oba atomy kyslíku a R^3 je atom vodíku,

i) reakcí sloučeniny obecného vzorce X



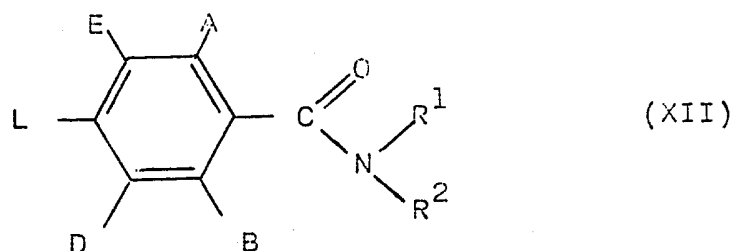
kde obecné symboly mají výše uvedený význam, s chloridem kyseliny vzorce R^4COCl , kde R^4 má výše uvedený význam, ve vhodném organickém rozpouštědle v přítomnosti base; nebo

ii) reakcí sloučeniny obecného vzorce XI



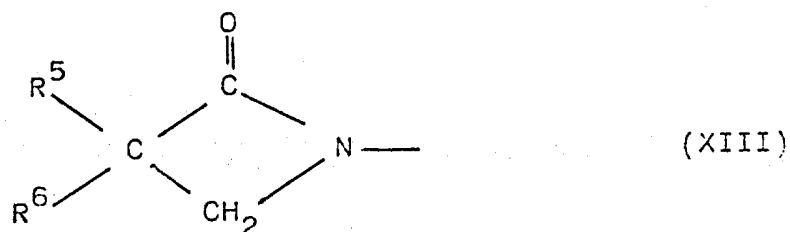
kde obecné symboly mají výše uvedený význam, s aminem vzorce R^1R^2NH , kde R^1 a R^2 mají výše uvedený význam, ve vhodném organickém rozpouštědle v přítomnosti base nebo nadbytku aminu R^1R^2NH ; nebo

iii) reakcí sloučeniny obecného vzorce XII



kde L je odštěpitelná skupina a ostatní symboly mají výše uvedený význam, se sloučeninou obecného vzorce $R^4-CO-NH_2$, kde R^4 má výše uvedený význam, a s basí; nebo

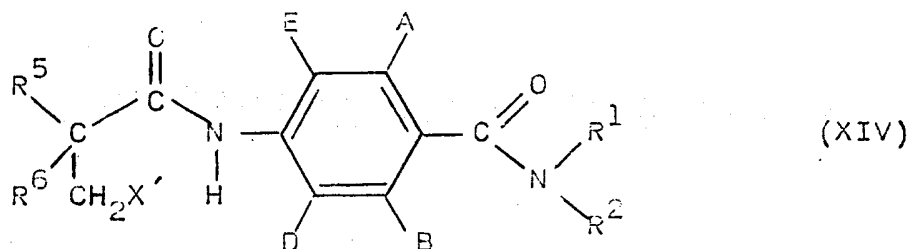
b) kde X a Y jsou oba atomy kyslíku a R^3 a R^4 spolu dohromady se skupinou $C(O)N$ tvoří kruh obecného vzorce XIII



kde R^5 a R^6 jsou nezávisle na sobě atom vodíku, alky-

lová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo atom halogenu,

i) reakcí sloučeniny obecného vzorce XIV



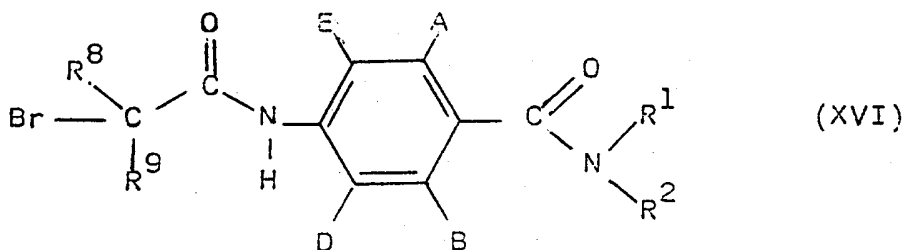
kde X' je atom chloru, bromu nebo jodu a ostatní obecné symboly mají výše uvedený význam, s basí ve dvou-fázovém systému obsahujícím organické rozpouštědlo a vodu v přítomnosti katalysátoru fázového přenosu; nebo

c) kde X a Y jsou oba atomy kyslíku, R³ je atom vodíku a R⁴ je skupina obecného vzorce XV



kde R⁸ a R⁹ jsou nezávisle na sobě atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,

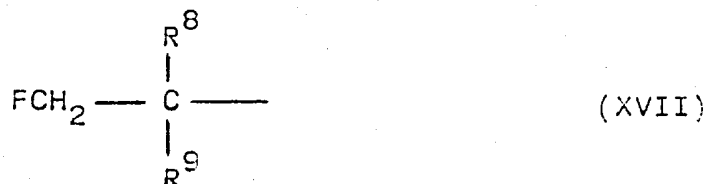
i) reakcí sloučeniny obecného vzorce XVI



kde obecné symboly mají výše uvedený význam,

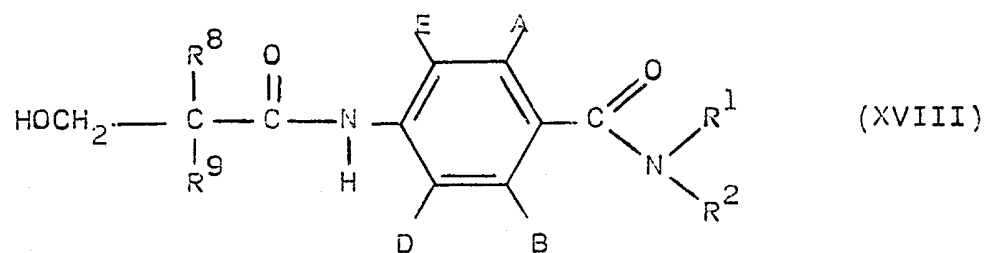
s činidlem přenášejícím fluorid ve vhodném rozpouštědle; nebo

- d) kde X a Y jsou oba atomy kyslíku, R^3 je atom vodíku a R^4 je skupina obecného vzorce XVII



kde obecné symboly mají výše uvedený význam,

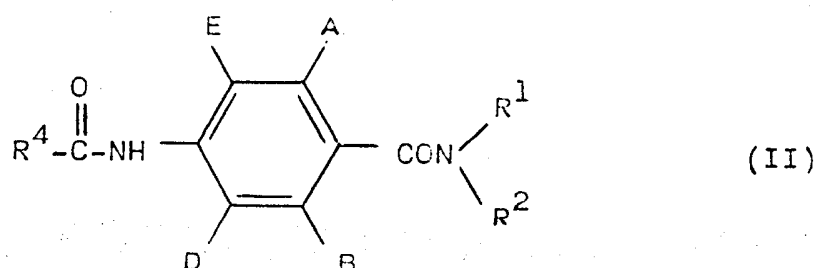
- i) reakcí sloučeniny obecného vzorce XVIII



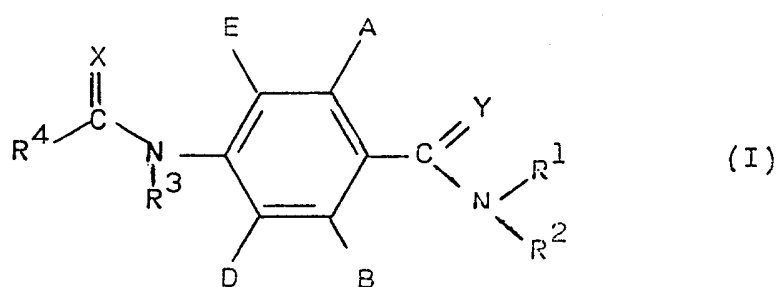
kde obecné symboly mají výše uvedený význam,
s fluoračním činidlem ve vhodném rozpouštědle;
nebo

- e) kde X je atom kyslíku nebo síry, Y je atom síry a R^3 je atom vodíku,

- i) reakcí sloučeniny obecného vzorce II



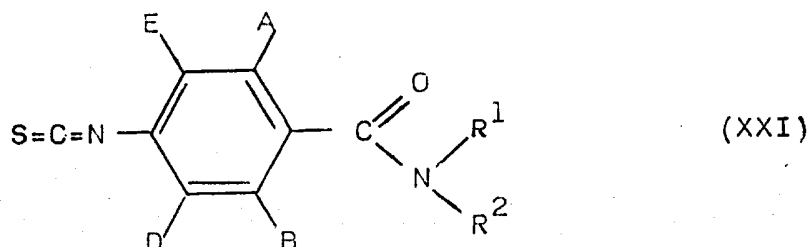
kde obecné symboly mají výše uvedený význam,
s thionačním činidlem ve vhodném rozpouštědle za
vzniku buď sloučeniny obecného vzorce I



kde X je atom kyslíku, Y je atom síry a R^3 je atom
vodíku, nebo směsí sloučeniny výše uvedeného obec-
ného vzorce I, kde X je atom kyslíku, Y je atom sí-
ry a R^3 je atom vodíku, a sloučeniny výše uvedeného
obecného vzorce I, kde X a Y jsou oba atomy síry a
 R^3 je atom vodíku; nebo

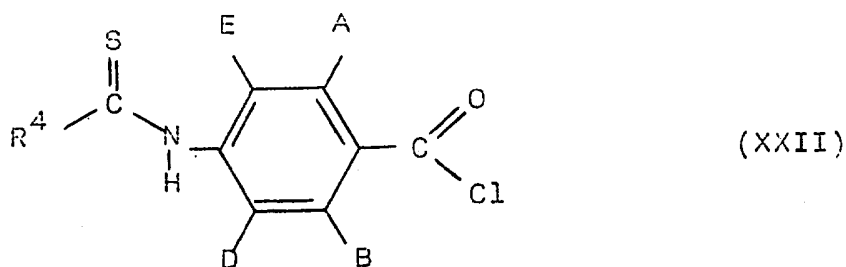
f) kde X je atom síry, Y je atom kyslíku a R^3 je atom vo-
díku,

1) reakcí isothiokyanátu obecného vzorce XXI



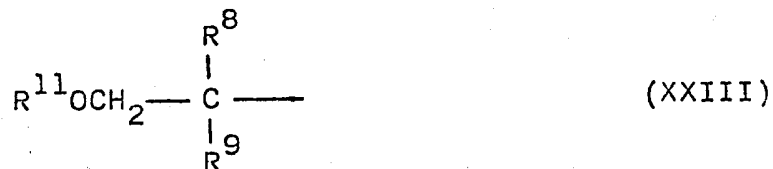
kde obecné symboly mají výše uvedený význam,
s organokovovým činidlem vzorce R^4Li nebo $R^4Mg-hal$,
kde R^4 má výše uvedený význam a hal je atom halogenu,
ve vhodném rozpouštědle při teplotě mezi $-78^\circ C$ a
 $+25^\circ C$; nebo

ii) reakcí chloridu kyseliny obecného vzorce XXII



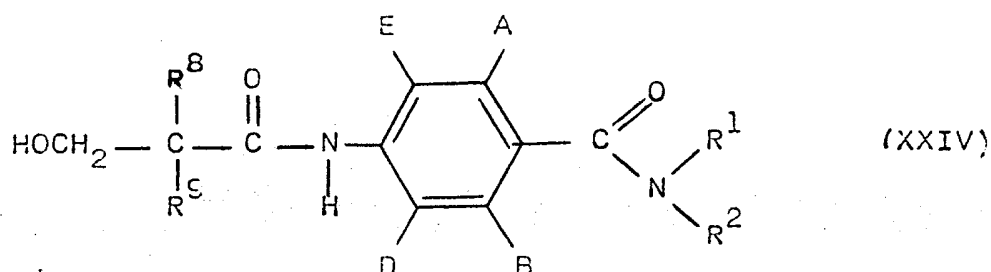
kde obecné symboly mají výše uvedený význam,
s aminem obecného vzorce R^1R^2NH , kde R^1 a R^2 ma-
jí výše uvedený význam, v přítomnosti base; nebo

g) kde X a Y jsou oba atomy kyslíku, R^3 je atom vodíku a
 R^4 je skupina obecného vzorce XXIII



kde R^{11} je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku a ostat-
ní obecné symboly mají výše uvedený význam,

i) reakcí sloučeniny obecného vzorce XXIV



kde obecné symboly mají výše uvedený význam, s halogenidem obecného vzorce $R^{11}\text{-hal}$, kde obecné symboly mají výše uvedený význam, v přítomnosti base ve vhodném rozpouštědle.

Sloučeniny podle předloženého vynálezu vykazují široké spektrum ~~XXXXXXXXXX~~ fungicidní účinnosti proti chorobám rostlin. Jsou zejména účinné proti třídám patogenů známých jako phycomycetes (ekvivalentní oomycetům). Jsou to zejména druhy *Phytophthora*, *Plasmopara*, *Perenospora* a *Pseudoperenospora*. Příklady patogenů, k jejichž hubení jsou sloučeniny podle předloženého vynálezu obzvláště vhodné jsou : *Plasmopara viticola* (perenospora révy vinné) na vinné révě, ostatní plísně, jako je *Bremia lactucae* (plíseň salátová) na salátu, *Perenospora* spp. na sóji, tabáku, cibuli a jiných hostitelských rostlinách, *Pseudoperenospora humuli* na chmelu a *Pseudoperenospora cubensis* na okurkách, *Phytophthora infestans* na bramborách a rajčatech a jiné druhy *Phytophthora* spp. na zelenině, jahodách, avokádu, pepřovníku, okrasných rostlinách, tabákovníku, kakaovníku a jiných hostitelských rostlinách a *Pythium* spp. na rýži, okrasných rostlinách, zelenině a trávniku.

Předložený vynález rovněž popisuje způsob potírání hub, který spočívá v tom, že se na rostlinu, na semeno rostliny nebo na místo, kde rostlina a semeno rostou, aplikuje fungicidně účinné množství sloučeniny po-

dle vynálezu nebo prostředku, který tuto sloučeninu obsahuje.

K zemědělským účelům je možno sloučeniny podle vynálezu používat přímo jako takové, ale účelněji se však za pomoci ředidla nebo nosiče zpracovávají na prostředky, které tyto sloučeniny obsahují.

Sloučeniny podle vynálezu je možno aplikovat řadou způsobů. Tak je možno například tyto sloučeniny aplikovat, ať už jako takové nebo upravené na příslušné prostředky, přímo na listy rostlin, na semena rostlin nebo na jiné prostředí, v němž se rostliny pěstují nebo mají pěstovat, nebo je lze aplikovat postřikem, poprašováním nebo ve formě krémovitého nebo pastovitého prostředku, nebo je lze aplikovat ve formě prachu nebo granulátu s pomalým uvolňováním účinné látky.

Ošetřovat je možno libovolnou část rostliny, například listy, stonky, větve nebo kořeny, nebo je možno ošetřovat půdu okolo kořenů nebo semena před zasetím. Účinné látky a prostředky podle vynálezu lze rovněž aplikovat do půdy obecně, do vody pro závlahová pole nebo do hydroponických kultivačních systémů. Sloučeniny podle vynálezu lze rovněž injekčně aplikovat do rostlin a lze je také aplikovat postřikem na vegetaci za použití elektrodynamických postřikových technik nebo jiných metod aplikace malých objemů účinných prostředků.

Výrazem "rostliny" se v tomto textu míní byliny, keře a stromy. Fungicidní prostředky podle vynálezu je možno používat k preventivnímu, protektivnímu, profylaktickému nebo ke kurativnímu ošetřování.

V zemědělství a zahradnictví se sloučeniny podle vynálezu s výhodou používají ve formě prostředků. Typ používaného prostředku v každém případě závisí na zamýšleném účelu, jehož se má dosáhnout.

Prostředky podle vynálezu mohou mít formu prachu nebo granulátů, které obsahují účinnou složku

(sloučeninu podle vynálezu) a pevné řadidlo nebo nosič, například plnidlo, jako kaolin, bentonit, křemelinu, dolomit, uhličitán vápenatý, mastek, práškový oxid hořečnatý, valchařskou hlinku, sádku, infusoriovou hlinku a pod. Tyto granuláty mohou být předem upraveny tak, že jsou vhodné k aplikaci do půdy bez dalšího zpracování. Tyto granuláty je možno vyrábět buď impregnací peletizovaného nosiče účinnou látkou nebo peletizací směsi účinné látky a práškového plnidla. Prostředky pro moření osiva mohou například obsahovat činidlo (například minerální olej) napomáhající přilnutí prostředku k osivu. Alternativně je možno účinnou složku upravovat k moření osiva za použití organického rozpouštědla (například N-methylpyrrolidonu, propylenglykolu nebo dimethylformamidu). Prostředky podle vynálezu mohou být rovněž ve formě smáčitelných prášků nebo ve vodě dispergovatelných granulí, obsahujících smáčecí nebo dispergační činidlo k usnadnění dispergování prášku do kapalin. Prášky nebo granuláty mohou také obsahovat plnidla a suspenzační činidla.

Emulgovatelné koncentráty nebo emulze je možno připravovat rozpuštěním účinné látky v organickém rozpouštědle obsahujícím případně smáčedlo nebo emulgátor a potom vnesením této směsi do vody, která také může obsahovat smáčedlo nebo emulgátor. Vhodnými organickými rozpouštědly jsou aromatická rozpouštědla, jako alkylbenzeny a alkylnaftaleny, ketony, jako cyklohexanon a methylcyklohexanon, chlorované uhlovodíky, jako chlorbenzen a trichlorethan, a alkoholy, jako benzylalkohol, furfurylalkohol, butanol a ethery glykolu.

Suspensní koncentráty prakticky nerozpustných pevných látek je možno připravit rozemláním v kulových mlýnech v přítomnosti dispergačního činidla a suspenzačního činidla, kterážto činidla mají za úkol zabránit usazování pevného materiálu.

Prostředky používané jako postřiky mohou být rovněž ve formě aerosolů, v kterémžto případě je prostředek udržován pod tlakem v zásobníku v přítomnosti propelantu, například fluortrichlormethanu nebo dichlordifluormethanu.

Sloučeniny podle vynálezu je možno mísit v suchém stavu s pyrotechnickými směsmi na prostředky vhodné v uzavřených prostorech k vyvíjení dýmu, obsahujícího tyto sloučeniny.

Alternativně je možno sloučeniny podle vynálezu používat v mikroenkapsulované formě. Sloučeniny podle vynálezu je také možno formulovat na biodegradabilní polymerní preparáty, čímž se při použití dosahuje pomalého a řízeného uvolňování účinné látky.

Jednotlivé prostředky je možno lépe adaptovat pro různá použití pomocí vhodných přísad zlepšujících distribuci, adhezi a resistenci vůči dešti na ošetřených površích. Pro zlepšení biologické účinnosti různých přípravků je možno přidávat ještě další přídavné látky. Těmito přídavnými látkami mohou být povrchově aktivní činidla, kterými se zlepšuje smáčení a retence na ~~ošetřených~~ površích ošetřených těmito přípravky a také absorpce a mobilita účinné látky. Dále mohou tyto přípravky obsahovat další přídavné látky na bázi olejů pro postřikování. Například bylo zjištěno, že přidáním určitého minerálního nebo přírodního rostlinného oleje (jako je sojový olej nebo řepkový olej) se dosáhne několikanásobně vyšší ochrany listů před například *Plasmopara viticola*.

Sloučeniny podle vynálezu je možno používat ve směsích s minerálními hnojivy, například s minerálními hnojivy obsahujícími dusík, draslík nebo fosfor. Výhodné jsou prostředky obsahující pouze granule hnojiva, do nichž byla inkorporována účinná látka podle vynálezu, například povlečením. Takovéto granule účelně obsahují až do 25 % hmotnostních sloučeniny podle vynálezu. Vynález tedy také zahrnuje hnojivé prostředky, které obsahují hnojivo a

sloučeninu obecného vzorce I nebo její sůl nebo komplex s kovem.

Směčitelné prášky, emulgovatelné koncentráty a suspenšní koncentráty normálně obsahují povrchově aktivní činidla, například smáčedla, dispergátory, emulgátory nebo suspendační činidla. Výše zmíněná činidla mohou být kationtového, aniontového nebo neionogenního typu.

Vhodnými kationtovými činidly jsou kvarterní amoniové sloučeniny, například cetyltrimethylamoniumbromid. Vhodnými aniontovými činidly jsou mýdla, soli alifatických monoesterů kyseliny sírové (například laurylsulfát sodný) a soli sulfonovaných aromatických sloučenin (například dodecylbenzensulfonát sodný, lignosulfonát nebo butyl-naftalensulfonát sodný, vápenatý nebo amonný nebo směs diisopropyl- a triisopropyl-naftalensulfonátů sodných).

Vhodnými neionogenními činidly jsou kondenzační produkty ethylenoxidu s mastnými alkoholy, jako s oleyl-alkoholem nebo s cetylalkoholem, nebo s alkylfenoly, jako s oktyl- nebo nonylfenolem a oktylkresolem. Dalšími neionogenními činidly jsou parciální estery odvozené od mastných kyselin s dlouhým řetězcem a anhydridů hexitolu, kondenzační produkty těchto parciálních esterů s ethylenoxidem a lecithiny. Vhodnými suspendačními činidly jsou hydrofilní koloidy (například polyvinylpyrrolidon a natrium-karboxymethylcelulosa) a botnadla, jako bentonit nebo attapulgit.

Prostředky pro použití ve formě vodných disperzí nebo emulzí se obecně dodávají ve formě koncentrátů obsahujících vysoký podíl účinné látky, kteréžto koncentráty se potom před použitím ředí vodou. Od zmíněných koncentrátů se požaduje, aby výhodně vydržely dlouhodobé skladování a aby i po tomto skladování je bylo možno ředit vodou na vodné preparáty, které by zůstaly homogenní tak dlouho, aby je bylo možno aplikovat běžným postřikovacími zařízeními. Koncentráty mohou účelně obsahovat až

do 95 % hmotnostních, účelně 10 až 85 % hmotnostních, například 25 až 60 % hmotnostních, účinné látky. Po zředění koncentrátů na vodné preparáty mohou tyto preparáty obsahovat různá množství účinné látky, a to v závislosti na zamýšleném účelu, k němuž se budou používat, obecně je však možno používat vodné preparáty obsahující od 0,0005 nebo 0,01 do 10 % hmotnostních účinné látky.

Prostředky podle vynálezu mohou obsahovat rovněž jiné sloučeniny vykazující biologickou účinnost, jako například sloučeniny mající podobnou nebo komplementární fungicidní účinnost nebo účinnost co do regulování růstu rostlin, herbicidní nebo insekticidní účinnost.

Takovýmito dalšími fungicidními sloučeninami mohou být například sloučeniny schopné potírat choroby klásků obilovin (například pšenice), jako choroby vyvolané druhy *Septoria*, *Gibberella* a *Helminthosporium* spp., choroby přenosné semenem a půdní choroby, jakož i perenosporu, plísně nebo padlí na vinné révě a padlí a strupovitost na jabloních a pod. Přidáním dalšího fungicidu mohou mít vzniklé směsi širší spektrum účinku než samotné sloučeniny obecného vzorce I. Dále pak mohou mít tyto další fungicidy synergický účinek na fungicidní účinnost sloučenin obecného vzorce I. Příklady fungicidních sloučenin, které mohou být včleněny do prostředků podle vynálezu jsou : (RS)-1-aminopropylfosfonová kyselina, (RS)-4-(4-chlorfenyl)-2-fenyl-2-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)-butyronitril, (Z)-N-2-butenyloxymethyl-2-chlor-2',6'-diethylacetanilid, 1-(2-kyan-2-methoxyiminoacetyl)-3-ethylmočovina, 3-(2,4-dichlorfenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-chinazolin-4(3H)-on, 4-brom-2-kyan-N,N-dimethyl-6-trifluormethylbenzimidazol-1-sulfonamid, 5-ethyl-5,8-dihydro-8-oxo(1,3)-dioxol-(4,5-g)chinolin-7-karboxylová kyselina, α -/N-(3-chlor-2,6-xylyl)-2-methoxyacetamido/- γ -butyrolakton, aldimorph, anilazin, benalaxyl, benomyl, biloxazol, binapacryl, bitertanol, blasticidin S, bromuconazol,

bupirimet, captafol, captan, carbendazim, carboxin, chlorbenzthiazon, chloroneb, chlorothalonil, chlorozoliat, sloučeniny obsahující měď, jako je oxychlorid mědi, síran měďnatý a Bordeauxská směs, cycloheximid, cyroxanil, cyproconazol, cyprofuram, di-2-pyridyldisulfid-1,1'-dioxid, dichlofluamid, dichlon, diclobutrazol, diclomezin, dicloran, difenoconazol, dimethamorph, dimethirimol, diniconazol, dinocap, ditalimfos, dithianon, dodamorph, dodin, edifenphos, etaconazol, ethirimol, ethyl-(Z)-N-benzyl-N-(/methyl-(methylthioethyladenamino-oxykarbonyl)amino/thio)- β alaninat, etridiazol, fenapanil, fenarimol, fenfuram, fenciclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fentin-acetát, fentin-hydroxid, flutolanil, flutriafol, flusilazol, folpet, fosetylaluminium, fuberidazol, furalaxyl, furconazol-cis, guazatin, hexaconazol, hydroxyisoxazol, imazalil, imibenconazol, iprobenfos, iprodion, isoprothiolan, kasugamycin, mancozeb, maneb, mepanipirim, mepronil, metalaxyl, methfuroxam, methsulfovax, myclobutanil, neosozin, dimethyldithiokarbamat nikelnatý, nitrothal-isopropyl, nuarimol, ofurace, organické sloučeniny rtuti, oxadixyl, oxycarboxin, pefurezoate, penconazol, pencycuron, phenazin-oxid, phthalid, polyoxin D, polyram, probenazol, prochloraz, procymidon, propamocarb, propiconazol, propineb, prothiocarb, pyrazophos, pyrifenox, pyroquilon, pyroxyfur, pyrrolnitrin, quinomethionat, quintozen, SSF-109, streptomycin, síra, tebuconazol, te-chlofthalam, tecnazen, tetraconazol, thiabendazol, thioyofen, thiophanat-methyl, thiram, tolclofos-methyl, 1,1'-iminodi(oktamethylen)diguanidin-triacetát, triadimefon, triadimenol, triazbutyl, tricyclazol, tridemorph, triforin, validamycin A, vinclozolin, zarilamid a zineb.

Sloučeniny obecného vzorce I je možno mísit s půdou, rašelinou nebo s jinými růstovými prostředky k ochraně rostlin proti chorobám přenosným semenem, půdním chorobám nebo listovým houbovým onemocněním.

Mezi vhodné insekticidy, které je možno přidávat do prostředků podle vynálezu, patří buprofezin, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, chl⁶pyrifos, cycloprothrin, demeton-s-methyl, diazinon, dimethoat, ethofenprox, fenitrothion, fenobucarb, fenthion, formothion, isoprocarb, isoxathion, monocrotophos, phenthoat, pirimicarb, propaphos a XMC.

Látkami regulujícími růst rostlin jsou sloučeniny, které brání klíčení nebo růstu plevelů nebo selektivně kontrolují růst méně žádoucích rostlin (například trav).

Jako příklady vhodných regulátorů růstu rostlin, které je možno používat v kombinaci se sloučeninami podle vynálezu, se uvádějí : 3,6-dichlorpikolinová kyselina, 1-(4-chlorfenyl)-4,6-dimethyl-2-oxo-1,2-dihydropyridin-3-karboxylová kyselina, methyl-3,6-dichloranisát, abscisová kyselina, asulam, benzoylprop-ethyl, carbetamid, daminozid, difenzoquat, dikegulac, ethephon, fenpentezol, fluoridamid, glyphosat, glyphosin, hydroxybenzonitrily (například bromoxynil), inabenfid, isopyrimol, mastné alkoholy a kyseliny s dlouhými řetězci, hydrazid kyseliny maleinové, mefluidid, morfaktiny (například chlorfluoroecol), paclobutrazol, fenoxyoctové kyseliny (například 2,4-D nebo MCPA), substituované benzoové kyseliny (například trijodbenzoová kyselina), substituované kvarterní amoniové a fosfoniové sloučeniny (například chloromequat, chlorphonium nebo mepiquatchlorid), tecnezen, auxiny (například indoloctová kyselina, indolmásečná kyselina, naftyloctová kyselina nebo naftoxyoctová kyselina), cytokininy (například benzimidazol, benzyladenin, benzylaminopurin, difenylmočovina nebo kinetin), gibereliny (například GA₃, GA₄ nebo GA₇) a triapehthenol.

Následující příklady blíže objasňují předložený vynález.

Příklady provedení vynálezu

V následujících příkladech se výrazem "ether" míní diethylether, k sušení roztoků se používá síran hořečnatý a zahušťování roztoků se provádí za sníženého tlaku. Kde jsou uvedena IČ a NMR spektra, jsou tato data selektivní, není tedy uváděn plný výčet všech absorpcí ve všech případech. V příkladové části se používají následující zkratky :

NMR = nukleární magnetická resonance

s = singlet

d = dublet

dd = dublet dubletů

t = triplet

m = multiplet

š = široký pík

P ř í k l a d 1

Tento příklad popisuje přípravu 4-trimethylacetamido-2-jod-N,N-dimethylbenzamidu (sloučenina č. 1 z tabulky I).

Stupeň 1

Příprava 4-nitro-2-trifluoracetamidobenzoové kyseliny

K míchané suspensi 4-nitroanthranilové kyseliny (10 g) v bezvodém etheru (600 ml) se přidá uhličitan sodný (80 g). Suspense se ochladí na 2 °C a po kapkách se přidává anhydrid trifluoroctové kyseliny (85 ml). Vzniklá žlutozelená směs se ohřeje na teplotu místnosti a míchá se 5 hodin před tím, než se naleje do chloroformu. Nadbytek anhydridu se rozruší ledem a organická vrstva se promyje vodou, vysuší, přefiltruje a zahustí se za sniže-

ného tlaku. Získá se oranžová pevná látka. Chromatografií na silikagelu a elucí směsí ethylacetát/hexan/kyselina octová (50:60:5) se získá 4-nitro-2-trifluoracetamidobenzoová kyselina (4 g) ve formě žluté pevné látky.

^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ 8,06 (1H, d), 8,38 (1H, d), 9,47 (1H, š s), 13,22 (1H, š s) ppm, teplota tání 130°C (rozklad).

Stupeň 2

Příprava 4-nitro-2-trifluoracetamido-N,N-dimethylbenzamidů

K míchané suspensi 4-nitro-2-trifluoracetamido-benzoové kyseliny (3,5 g) a dimethylformamidu (3 kapky) v dichlormethanu (30 ml) se pomalu přidává oxalylchlorid (1,1 ml). Aby se směs rozpustila, přidá se další dichlormethan (70 ml) a směs se míchá 1,5 hodiny a potom se pomalu přidá při 5°C k dimethylaminu (40 % hmot./hmot., vodný roztok, 14 ml) a 4-dimethylaminopyridinu (katalytické množství). Vzniklá jasně žlutá směs se míchá 1,5 hodiny při teplotě 5°C , potom se promyje zředěnou vodnou kyselinou chlorovodíkovou, nasyceným vodným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a vodou. Organická vrstva se vysuší, přefiltruje a zahustí za sníženého tlaku. Získá se žlutý olej, (3 g), který ztuhne po zpracování směsí ethylacetátu a hexanu (1:1). Rozmělněním s malým množstvím směsí ethylacetátu a hexanu (1:1) se získá 4-nitro-2-trifluoracetamido-N,N-dimethylbenzamid ve formě světle žluté pevné látky (1,85 g).

^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ 3,15 (6H, š s), 7,55 (1H, d), 8,08 (1H, dd), 9,18 (1H, s), 10,55 (1H, s) ppm, teplota tání $139,5$ až $140,5^\circ\text{C}$.

Stupeň 3

Příprava 4-amino-2-trifluoracetamido-N,N-dimethylbenzamidů

Palladium na uhlí (10 %, katalytické množství) se dobře propláchne argonem. Přidá se 4-nitro-2-trifluoracetamido-N,N-dimethylbenzamid (1,3 g) v methanolu (4,5 ml), reakční nádoba se propláchne třikrát vodíkem a udržuje se v atmosféře vodíku po dobu 3 hodin. Směs se dvakrát přefiltruje přes hyflo a přefiltrováním přes filtrační papír se odstraní katalysátor. Zahuštěním za sníženého tlaku se získá 4-amino-2-trifluoracetamido-N,N-dimethylbenzamid ve formě světle žluté pevné látky (1,09 g).

^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ 3,1 (6H, s), 4,7 (2H, s), 6,45 (1H, dd), 7,17 (1H, d), 7,68 (1H, s), 11,4 (1H, s), ppm, teplota tání 170 až 171 °C.

Stupeň 4

Příprava 4-trimethylacetamido-2-trifluoracetamido-N,N-dimethylbenzamidů

K míchanému roztoku 4-amino-2-trifluoracetamido-N,N-dimethylbenzamidů (800 mg), triethylaminu (610 μl) a 4-dimethylaminopyridinu (katalytické množství) v dichlormethanu (40 ml) se přidá po kapkách trimethylacetylchlorid (348 μl). Po 18 hodinách se reakční směs promyje zředěnou vodnou kyselinou chlorovodíkovou, nasyceným vodným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a vodou, vysuší se, přefiltruje a zahuštěním za sníženého tlaku se získá oranžový olej, který po rozmělnění s hexanem vykristaluje. Chromatografií na silikagelu a elucí směsí hexanu a ethylacetátu (1:1) se získá 4-trimethylacetamido-2-trifluoracetamido-N,N-dimethylbenzamid ve formě bílých krystalů, ^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ 1,3 (9H, s), 3,1 (6H, s), 7,45 (1H, d), 7,68 (1H, s), 7,96 (1H, dd), 8,1 (1H, s) ppm, teplota tání 190 až 191 °C.

Stupeň 5

Příprava 4-trimethylacetamido-2-amino-N,N-dimethylbenzamidů

K míchanému roztoku uhličitanu draselného ve vodném methanolu (40 ml, 7 %, 2:5 obj./obj.) se přidá 4-trimethylacetamido-2-trifluoracetamido-N,N-dimethylbenzamid (360 mg). Po 32 hodinách se reakční směs naleje do vody a produkt se extrahuje etherem (2 x). Spojené organické extrakty se vysuší, přefiltrují a zahuštěním za sníženého tlaku se získá 4-trimethylacetamido-2-amino-N,N-dimethylbenzamid ve formě žluté pevné látky (164 mg). ^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ 1,3 (9H, s), 3,05 (6H, s), 4,65 (1H, s), 6,85 (1H, dd), 7,03 (1H, d), 7,22 (1H, s), 8,10 (1H, s) ppm, teplota tání 175 až 175,5 °C.

Stupeň 6

Příprava 4-trimethylacetamido-2-jod-N,N-dimethylbenzamidů

K míchanému roztoku 4-trimethylacetamido-2-amino-N,N-dimethylbenzamidů (740 mg) v koncentrované vodné kyselině chlorovodíkové (5 ml) se přidá roztok dusitanu sodného (220 mg) ve vodě (1 ml), přičemž se teplota udržuje pod 0 °C. Potom se 15 minut udržuje reakční směs při teplotě -2 °C, načež se přidá vodný roztok jodidu draselného (560 mg ve 2 ml) a reakční směs se míchá přes noc. Směs se rozpustí v ethylacetátu a promyje se vodným roztokem hydroxidu sodného (10 %), vodou, vodným roztokem síranu sodného (5 %) a vodou. Organický extrakt se vysuší, přefiltruje a zahuštěním za sníženého tlaku se získá žlutá pevná látka (610 mg). Chromatografií na silikagelu a elucí ethylacetátem se získá 4-trimethylacetamido-2-jod-N,N-dimethylbenzamid ve formě světle žluté pevné látky (200 mg). ^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ 1,3 (9H, s), 2,85 (3H, s), 3,12 (3H, s), 7,02 (1H, d), 7,47 (1H, s), 7,9 (1H, s), 8,0 (1H, s) ppm, teplota tání 228,5 až 230,5 °C.

P ř í k l a d 2

Tento příklad popisuje přípravu 4-(2-fluor-2-methylpropanemido)-2-jod-N,N-dimethylbenzamidů (sloučenina č. 5 z tabulky I).

Stupeň 1

Příprava 2-jod-4-nitrobenzoové kyseliny

K míchanému roztoku 4-nitroanthranilové kyseliny (1,82 g) v koncentrované kyselině chlorovodíkové (vodné) (30 ml) ochlazené na -5°C se přidá dusitan sodný (760 mg) ve vodě (3 ml), přičemž se teplota udržuje pod 0°C . Reakční směs se ochladí na -5°C a po 15 minutách se přidá k roztoku jodidu draselného (2 g) ve vodě (10 ml) a míchá se po dobu 20 hodin. Směs se zředí ethylacetátem a organická vrstva se promyje 10 % vodným roztokem thiosíranu sodného, vysuší se (MgSO_4) a zahuštěním za sníženého tlaku se získá žlutá pevná látka (1,83 g), která se použije bez dalšího čištění ve stupni 2.

^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ 8,12 (1H, d), 8,3 (1H, dd), 8,8 (1H, d) ppm.

Stupeň 2

Příprava 2-jod-4-nitro-N,N-dimethylbenzamidů

K míchané suspensi 2-jod-4-nitrobenzoové kyseliny (23 g) v dichlormethanu (200 ml) se v atmosféře dusíku přidá po kapkách oxalylchlorid (6,7 ml). Po 2,5 hodinách se veškerá pevná látka rozpustí. Roztok se přidá k dimethylaminu (40 % vodný, 41 ml) a vzniklá směs se míchá po dobu 4,5 hodiny. Dichlormethanový roztok se promyje zředěnou vodnou kyselinou chlorovodíkovou, nasyceným vodným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a vodou a vysuší se (MgSO_4). Zahuštěním za sníženého tlaku se získá produkt ve formě temně žluté pevné látky (22,09 g).

^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ 2,85 (3H, s), 3,18 (3H, s), 7,39 (1H, d), 8,28 (1H, dd), 8,69 (1H, dd) ppm.

Stupeň 3

Příprava 4-amino-2-jod-N,N-dimethylbenzamidu

2-jod-4-nitro-N,N-dimethylbenzamid (1,28 g) se přidá po částech k roztoku chloridu cínatého (2,3 g) v koncentrované vodné kyselině chlorovodíkové při teplotě 0 °C. Reakční směs se ohřeje na teplotu místnosti po 20 minutách. Po 1 hodině se směs naleje do vody, zalkalizuje se vodným hydroxidem sodným a extrahuje se dvakrát dichlormethanem. Spojené organické extrakty se vysuší (MgSO_4) a zahuštěním za sníženého tlaku se získá produkt ve formě žluté pevné látky (950 mg).

^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ 2,86 (3H, s), 3,10 (3H, s), 3,79 (2H, s), 6,65 (1H, dd), 6,97 (1H, d), 7,12 (1H, dd) ppm.

Stupeň 4

Příprava 4-(2-fluor-2-methylpropanamido)-2-jod-N,N-dimethylbenzamidu

Roztok 2-fluor-2-methylpropanoylchloridu se připraví reakcí 2-fluor-2-methylpropanové kyseliny (426 mg) a dimethylformamidu (2 kapky) v dichlormethanu (5 ml) s oxalylchloridem (350 μl) a mícháním po dobu 1,5 hodiny. Tento roztok se přidá po kapkách k míchanému roztoku 4-amino-2-jod-N,N-dimethylbenzamid (950 mg), triethylaminu (0,7 ml) a N,N-dimethylaminopyridinu (katalytické množství) v dichlormethanu (45 ml) a směs se míchá po dobu 2 hodin. Roztok se promyje zředěnou vodnou kyselinou chlorovodíkovou, nasyceným vodným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a vodou, vysuší se (MgSO_4) a zahustí se za sníženého tlaku. Získá se žlutá pěna (985 mg). Chromatografií na silikagelu a elucí ethylacetátem se získá produkt ve formě krémovité pevné látky (850 mg), teplota tání 165,5 až 168 °C.

P ř í k l a d 3

Tento příklad popisuje přípravu 4-(2-fluor-2-methylpropanamido)-2-ethinyl-N,N-dimethylbenzamid (sloučenina č. 33 z tabulky I).

Stupeň 1

Příprava 4-nitro-2-(2-trimethylsilylethynyl)-N,N-dimethylbenzamid

Směs 2-jod-4-nitro-N,N-dimethylbenzamid (z příkladu 2, stupně 2) (1,92 g), trimethylsilylethinu (1 ml), bis(trifenylfosfin)-palladium-II-chloridu (192 mg), jodidu měďného (192 mg) a triethylaminu (1,3 ml) v acetonitrilu (40 ml) se míchá v atmosféře dusíku po dobu 2 hodin. Reakční směs se zředí etherem, promyje zředěnou vodnou kyselinou chlorovodíkovou, vodou a vodným amoniakem, vysuší se (MgSO_4) a zahustí se za sníženého tlaku. Získá se produkt ve formě žluté pevné látky.

^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ (mezi jiným) 2,90 (3H, s), 3,15 (3H, s), 7,50 (1H, d), 8,20 (1H, dd), 8,32 (1H, d) ppm.

Stupeň 2

Příprava 4-nitro-2-ethinyl-N,N-dimethylbenzamid

4-nitro-2-(2-trimethylsilylethynyl)-N,N-dimethylbenzamid (1,58 g) se rozpustí v methanolu (30 ml) a v jedné dávce se přidá uhličitan draselný (200 mg). Po 1 hodině se pevné látky odstraní filtrací a filtrát se zahustí za sníženého tlaku a znovu se rozpustí v dichlormethanu. Vzniklý roztok se promyje vodou, vysuší se (MgSO_4) a zahustí se za sníženého tlaku. Získá se temně žlutá pevná látka, která se bez dalšího čištění použije ve stupni 3.

^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ 2,90 (3H, s), 3,35 (1H, s), 3,18 (3H, s), 7,50 (1H, d), 8,25 (1H, dd), 8,39 (1H, d) ppm.

Stupeň 3

Příprava 4-amino-2-ethinyl-N,N-dimethylbenzamidu
4-nitro-2-ethinyl-N,N-dimethylbenzamid (960 mg) se přidá po částech k roztoku chloridu cínatého (2,5 g) v koncentrované vodné kyselině chlorovodíkové (30 ml) při teplotě 0 °C. Po 1 hodině se směs naleje do vody a zalkalizuje se vodným hydroxidem sodným. Vodná vrstva se extrahuje dichlormethanem, vysuší se (MgSO_4) a zahustí se za sníženého tlaku. Získá se žlutý olej (760 mg), který se bez dalšího čištění použije ve stupni 4.

^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ 2,90 (3H, s), 3,10 (3H, s), 3,10 (1H, s), 3,80 (2H, š s), 6,68 (1H, dd), 6,79 (1H, d), 7,10 (1H, d) ppm.

Stupeň 4

Příprava 4-(2-fluor-2-methylpropanamido)-2-ethinyl-N,N-dimethylbenzamidu

Roztok 2-fluor-2-methylpropanoylchloridu se připraví reakcí 2-fluor-2-methylpropanové kyseliny (263 mg) a dimethylformamidu (3 kapky) v dichlormethanu (10 ml) s oxalylchloridem (215 μl) a mícháním po dobu 1,5 hodiny. Tento roztok se přidá po kapkách k míchanému roztoku 4-amino-2-ethinyl-N,N-dimethylbenzamidu (360 mg), triethylaminu (0,6 ml) a N,N-dimethylaminopyridinu (katalytické množství) v dichlormethanu (25 ml) a reakční směs se míchá po dobu 1,5 hodiny. Roztok se promyje zředěnou vodnou kyselinou chlorovodíkovou, nasyceným vodným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a vodou, vysuší se (MgSO_4) a zahustí se za sníženého tlaku. Získá se hnědý olej (590 mg), který stáním vykristaluje. Chromatografií na silikagelu a elucí ethylacetátem se získá produkt ve formě žlutého oleje, který stáním vykristaluje (317 mg).

teplota tání 110 °C (rozklad).

P ř í k l a d 4

Tento příklad popisuje přípravu 4-(2-fluor-2-methylpropanamido)-2-ethenyl-N,N-dimethylbenzamid (sloučenina č. 34 z tabulky I).

Stupeň 1

Příprava 4-nitro-2-ethenyl-N,N-dimethylbenzamid
Míchaná směs 2-jod-4-nitro-N,N-dimethylbenzamid (z příkladu 2, stupeň 2) (1 g), bis(trifenylfosfin)palladium-II-chloridu (80 mg) a vinyltributylcín (915 μ l) v bezvodém dimethylformamidu (20 ml) se zahřívá na 70 °C v atmosféře dusíku po dobu 12 hodin. Ochlazená reakční směs se přidá k vodnému fluoridu draselnému (10 %) a etheru a vzniklá reakční směs se míchá po dobu 1 hodiny a potom se přefiltruje přes hyflo. Etherová vrstva se oddělí a vodná vrstva se dále extrahuje etherem. Spojené etherové extrakty se promyjí roztokem chloridu sodného, vysuší se (MgSO_4) a zahustí se za sníženého tlaku. Získá se oranžový olej, který se rozmělní s hexanem. Zbytek se použije bez dalšího čištění ve stupni 2.

^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ 2,50 (3H, s), 3,16 (3H, s), 5,52 (1H, d), 5,95 (1H, d), 6,73 (1H, dd), 7,40 (1H, d), 8,15 (1H, dd), 8,44 (1H, d) ppm.

Stupeň 2

Příprava 4-amino-2-ethenyl-N,N-dimethylbenzamid

4-nitro-2-ethenyl-N,N-dimethylbenzamid (690 mg) se přidá po částech k roztoku chloridu cínatého (1,8 g) v koncentrované vodné kyselině chlorovodíkové (30 ml) při teplotě 0 °C. Po 1 hodině se směs naleje do vody a zalkalísuje se vodným hydroxidem sodným. Nerozpustné látky se

odfiltrují. Vodná vrstva se extrahuje dichlormethanem, vysuší se (MgSO_4) a zahustí se za sníženého tlaku. Získá se žlutý olej (457 mg), který se použije bez dalšího čištění ve stupni 3.

^1H NMR (CDCl_3 , 270 MHz) δ 2,80 (3H, s), 3,11 (3H, s), 3,78 (2H, s), 5,26 (1H, d), 5,67 (1H, d), 6,61 (1H, dd), 6,65 (1H, dd), 6,85 (1H, d), 7,03 (1H, d) ppm.

Stupeň 3

Příprava 4-(2-fluor-2-methylpropanamido)-2-ethenyl-N,N-dimethylbenzamidu

Roztok 2-fluor-2-methylpropanoylchloridu se připraví reakcí 2-fluor-2-methylpropanové kyseliny (300 mg) a dimethylformamidu (2 kapky) v dichlormethanu (5 ml) s oxalylchloridem (250 μl) a mícháním po dobu 1 hodiny. Tento roztok se přidá po kapkách k míchanému roztoku 4-amino-2-ethenyl-N,N-dimethylbenzamidu (450 mg), triethylaminu (0,5 ml) a N,N-dimethylaminopyridinu (katalytické množství) v dichlormethanu (20 ml) a směs se míchá po dobu 1 hodiny. Vzniklý roztok se promyje zředěnou vodnou kyselinou chlorovodíkovou, nasyceným vodným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a vodou, vysuší se (MgSO_4) a zahustí se za sníženého tlaku. Získá se žlutý olej, který stáním vykristaluje. Rekrystalizací ze směsi ethylacetátu a hexanu se získá produkt ve formě žlutých krystalů (327 mg), teplota tání 164 až 165 $^{\circ}\text{C}$.

V následující části jsou uvedeny příklady prostředků vhodných pro použití v zemědělství a zahradnictví, které je možno vyrábět za použití sloučenin podle vynálezu jako účinných látek. Tyto prostředky jsou také předmětem předloženého vynálezu. Uváděnými procenty se míní procenta hmotnostní.

P ř í k l a d 5

Smísením a mícháním následujících složek až do úplného rozpuštění se vyrobí emulgovatelný koncentrát:

sloučenina č. 1 z tabulky I	10 %
benzylalkohol	30 %
dodecylbenzensulfonát vápenatý	5 %
ethoxylovaný nonylfenol (13 mol ethylenoxidu)	10 %
alkylbenzeny	45 %

P ř í k l a d 6

Účinná látka se rozpustí v methylenchloridu a roztok se nastříká na granule attapulgitické hlíny. Rozpouštědlo se potom nechá odpařit, čímž se získá prostředek ve formě granulátu mající následující složení:

sloučenina č. 1 z tabulky I	5 %
granulovaný attapulgit	95 %

P ř í k l a d 7

Rozemletím a smísením následujících tří složek se připraví prostředek vhodný k moření osiva:

sloučenina č. 1 z tabulky I	50 %
minerální olej	2 %
kaolin	48 %

P ř í k l a d 8

Rozemletím a smísením účinné látky s mastkem se připraví popraš mající následující složení:

sloučenina č. 1 z tabulky I	5 %
mastek	95 %

P ř í k l a d 9

Rozemletím níže uvedených složek v kulovém mlýnu se připraví suspensní koncentrát, který se smísením s vodou převede na vodnou suspensi:

sloučenina č. 1 z tabulky I	40 %
lignosulfonát sodný	10 %
bentonit	1 %
voda	49 %

Tento prostředek je možno po zředění vodou používat jako postřik nebo jej lze aplikovat přímo na osivo.

P ř í k l a d 10

Smísením níže uvedených složek a rozemláním směsi až do homogenity se připraví prostředek ve formě smáčitelného prášku:

sloučenina č. 1 z tabulky I	25 %
laurylsulfát sodný	2 %
lignosulfonát sodný	5 %
silikagel	25 %
kaolin	43 %

P ř í k l a d 11

Sloučeniny podle vynálezu byly testovány co do účinnosti proti řadě houbových chorob rostlin. Test se provádí následujícím způsobem.

Rostliny se pěstují v květináčích o průměru 4 cm, naplněných kompostovkou John Innes (č. 1 nebo 2). Testované sloučeniny se na příslušné prostředky upravují buď tak, že se rozemelou v kulovém mlýnu s vodným preperátem Dispersolem T nebo že se rozpustí v acetonu nebo ve směsi acetonu a ethanolu a těsně před použitím se zředí na požadovanou koncentraci. V případě houbových

chorob napadajících listy rostlin se testovanými prostředky obsahujícími 100 ppm účinné látky postřikají listy a prostředek se rovněž aplikuje na kořeny rostlin v půdě. Postřiky se aplikují do maximální retence postřikové kapaliny na listech a zálivky kořenů do finální koncentrace odpovídající zhruba 40 ppm účinné látky v suché půdě. Pokud se postřiky aplikují na obiloviny, přidává se k nim povrchově aktivní činidlo Tween 20 až do finální koncentrace 0,05 %.

Ve většině testů se účinná látka aplikuje do půdy (ošetření kořenů) a na listy rostlin (postřikem) jeden nebo dva dny před tím, než se rostlina inokuluje houbou vyvolávající chorobu. Výjimkou je test proti *Erysiphe graminis*, při němž se rostliny inokulují 24 hodin před ošetřením. Pathogenní houby napadající listy se aplikují tak, že se suspenze jejich spor postřikají listy pokusných rostlin. Po inokulaci se rostliny umístí do vhodného prostředí umožňujícího rozvinutí choroby a pak se inkubují až do té doby, kdy je možno rozsah choroby vyhodnocovat. Časové období mezi inokulací a vyhodnocováním se pohybuje od 4 do 14 dnů v závislosti na chorobě a prostředí.

Rozsah potlačení choroby se vyjadřuje za pomoci následující stupnice:

- 4 = žádné onemocnění
- 3 = stopové až 5 % onemocnění, vztaženo na neošetřené rostliny
- 2 = 6 až 25 % onemocnění, vztaženo na neošetřené rostliny
- 1 = 26 až 59 % onemocnění, vztaženo na neošetřené rostliny
- 0 = 60 až 100 % onemocnění, vztaženo na neošetřené rostliny

Dosažené výsledky jsou uvedeny v tabulce II.

T a b u l k a II

slouč. číslo	Pr	Egt	Sn	Po	Vi	Pv	Pil
1	0	0	0	0	0	4	4
5	0 ^a	0 ^a	0 ^a	0 ^a	0 ^a	4 ^a	4 ^a
13	0	3	3	3	4	3	3
19	0 ^a	0 ^a	0 ^a	0 ^a	3 ^a	0 ^a	0 ^a
23	0 ^a	0 ^a	0 ^a	0 ^a	0 ^a	4 ^a	0 ^a
29	-	1	1	-	0	0	0
30	-	-	-	-	-	4 ^b	0 ^b
31	-	-	-	-	-	4 ^b	3 ^b
32	-	-	-	-	-	4 ^b	3 ^b
33	-	0	-	0	0	4	4
34	-	0	-	0	4	4	4
35	-	0	-	0	0	4	4

a = kořenová zálivka aplikováno pouze cca 25 ppm

b = kořenová zálivka aplikováno pouze cca 100 ppm

rostlinné choroby

Pr *Puccinia recondita*

Egt *Erysiphe graminis tritici*

Sn *Septoria nodorum*

Po *Pyricularia oryzae*

Vi *Venturia inaequalis*

Pv *Plasmopara viticola*

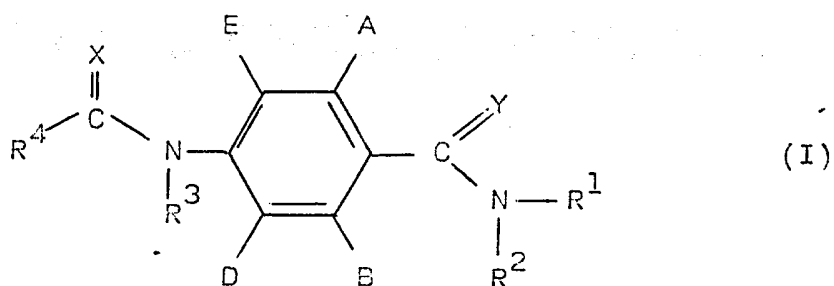
Pil *Phytophthora infestans lycopersici*

Průmyslová využitelnost

Sloučeniny podle vynálezu jsou použitelné jako fungicidy k ochraně rostlin.

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. Sloučenina obecného vzorce I



ke kterém

A a B jsou nezávisle na sobě atom vodíku, atom jodu, nitroskupina, kyanoskupina, alkoxykarbonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxyly, alkoxyalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxyly a s 1 až 4 atomy uhlíku v alkyly, alkylthioalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylech, formylová skupina, alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylkarbonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkyly, skupina $-CR^5=NOR^6$, kde R^5 a R^6 jsou nezávisle na sobě atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, dále znamenají A a B alkenylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku nebo alkinylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku, přičemž A a B nejsou současně atomy vodíku,

D a E jsou nezávisle na sobě atom vodíku nebo atom fluoru,
 R^1 je atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,
 R^2 je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo popřípadě substituovaná fenylová skupina, nebo

R^1 a R^2 spolu dohromady s atomem dusíku, ke kterému jsou připojeny, tvoří morfolinový, piperidinový, pyrrolidinový nebo azetidinový kruh, který je popřípadě substituován alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku,

R^3 je atom vodíku,

R^4 je trichlormethyl, alkylová skupina se 2 až 8 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována atomem halogenu, alkoxylovou skupinou s 1 až 8 atomy uhlíku nebo skupinou $R'S(O)_n$, kde R' je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkenylová skupina se 2 až 4 atomy uhlíku nebo alkinylová skupina se 2 až 4 atomy uhlíku a n je 0, 1 nebo 2, dále je R^4 cyklopropylová skupina, která je popřípadě substituována atomem halogenu nebo alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, dále alkenylová skupina se 2 až 8 atomy uhlíku, alkinylová skupina se 2 až 8 atomy uhlíku nebo alkoxylová skupina se 2 až 8 atomy uhlíku, přičemž každá z těchto skupin je popřípadě substituována atomem halogenu, dále mono- nebo dialkylaminoskupina s 1 až 4 atomy uhlíku v každém z alkylů, nebo skupina $R''ON=C(CN)$, kde R'' je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

R^3 a R^4 spolu dohromady se skupinou $C(O)N$, ke které jsou připojeny, tvoří azetidin-2-onový kruh, který je popřípadě substituován atomem halogenu nebo alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, a

X a Y jsou nezávisle na sobě kyslík nebo síra.

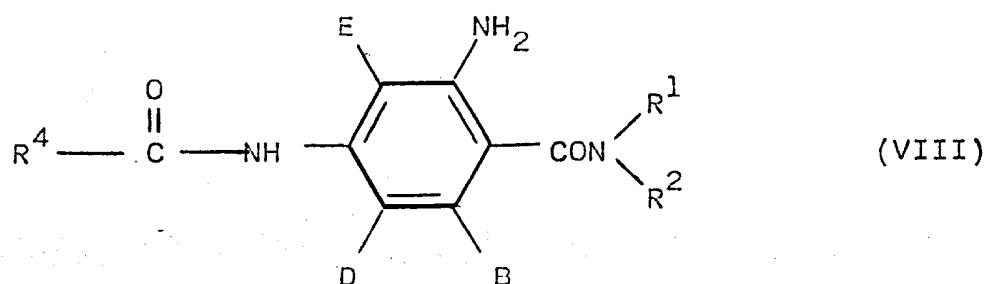
2. Sloučenina obecného vzorce I podle nároku 1, kde R^4 je $R(CH_3)_2C$, kde R je atom halogenu, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku.

3. Sloučenina obecného vzorce I podle nároku 1, kde R^4 je $F(CH_3)_2C$.

4. Sloučenina obecného vzorce I podle nároku 1, kde R^4 je $F(R^8)(R^9)C$, kde R^8 a R^9 jsou nezávisle na sobě atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku.

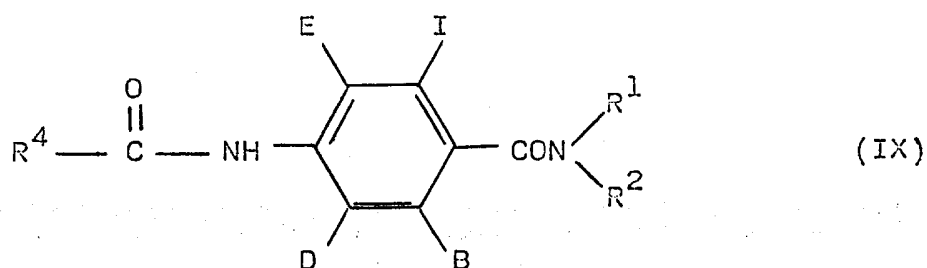
5. Sloučenina obecného vzorce I podle nároku 1, kde A je atom jodu, kyanoskupina, nitroskupina, alkoxykarbonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxyly, alkylkarbonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylu, alkoxyalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxyly a 1 až 4 atomy uhlíku v alkylu, alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, formylová skupina, alkylthioalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v každém z alkylů nebo skupina $-CH=NOR^6$, kde R^6 je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, R^1 a R^2 jsou alkylové skupiny, R^3 , B, D a E jsou atomy vodíku, R^4 je alkylová skupina se 2 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovaná atomem halogenu nebo alkoxylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, a X a Y jsou oba atomy kyslíku.

6. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce I podle nároku 1, kde A je atom jodu, R^3 je atom vodíku a X a Y jsou oba atomy kyslíku, vyznačený tím, že se nechá reagovat sloučenina obecného vzorce VIII



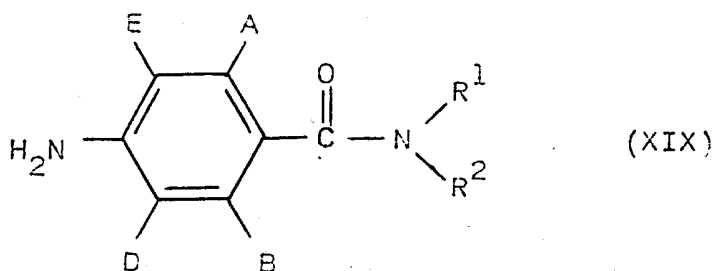
kde B, D, E, R^1 , R^2 a R^4 mají význam uvedený v nároku 1, s kyselinou dusitou a se zdrojem jodu.

7. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce I podle nároku 1, kde A je kyanoskupina nebo alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, R^3 je atom vodíku a X a Y jsou oba atomy kyslíku, vyznačený tím, že se nechá reagovat sloučenina obecného vzorce IX



kde B, D, E, R^1 , R^2 a R^4 mají význam uvedený v nároku 1, s kyanidem nebo alkanthiolátem s 1 až 4 atomy uhlíku přechodového kovu ve vhodném rozpouštědle.

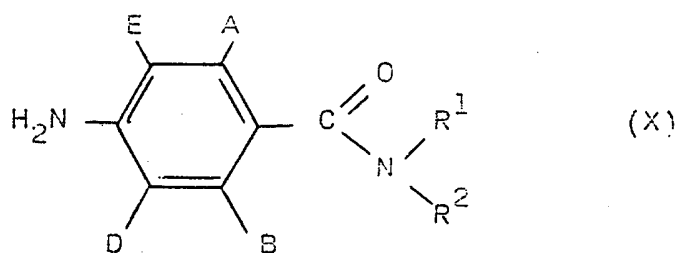
8. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce I podle nároku 1, kde X a Y jsou oba atomy kyslíku, vyznačený tím, že se nechá reagovat sloučenina obecného vzorce XIX



kde A, B, D, E, R^1 a R^2 mají význam uvedený v nároku 1, s chloridem kyseliny vzorce $R^4\text{COCl}$, kde R^4 má význam uvedený v nároku 1, ve vhodném rozpouštědle v přítomnosti base.

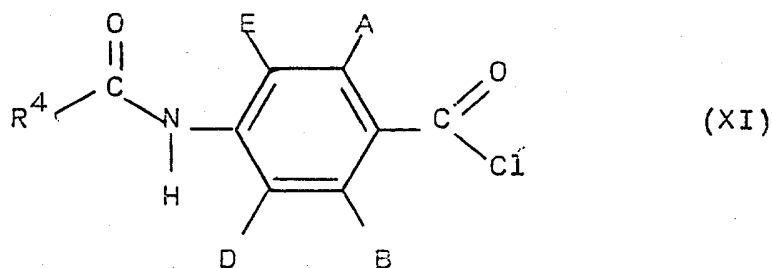
9. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce I podle nároku 1, vyznačený tím, že

- a) když X a Y jsou oba atomy kyslíku a R^3 je atom vodíku,
- i) se nechá reagovat sloučenina obecného vzorce X



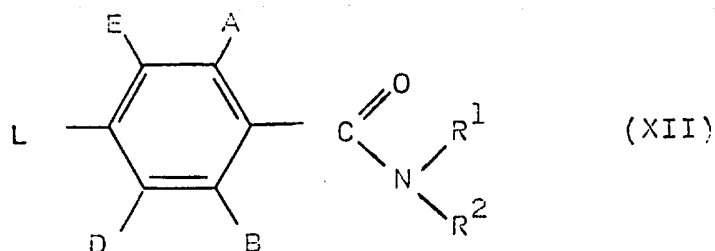
kde A, B, D, E, R^1 a R^2 mají význam uvedený v nároku 1, s chloridem kyseliny vzorce $R^4\text{COCl}$, kde R^4 má význam uvedený v nároku 1, ve vhodném organickém rozpouštědle v přítomnosti base,

- ii) se nechá reagovat sloučenina obecného vzorce XI



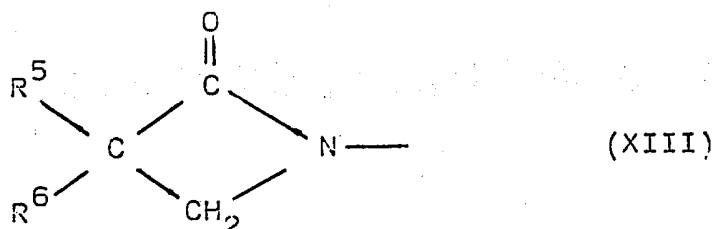
kde A, B, D, E a R^4 mají význam uvedený v nároku 1,

s aminem vzorce R^1R^2NH , kde R^1 a R^2 mají význam uvedený v nároku 1, ve vhodném organickém rozpouštědle v přítomnosti base nebo nadbytku aminu R^1R^2NH , nebo
iii) se nechá reagovat sloučenina obecného vzorce XII

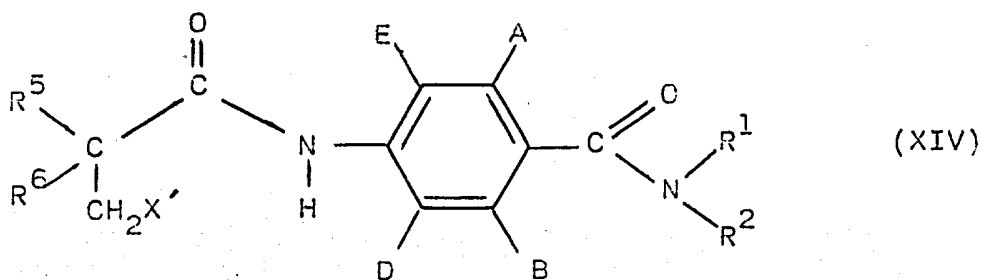


kde L je odštěpitelná skupina a A, B, D, E, R^1 a R^2 mají význam uvedený v nároku 1, se sloučeninou vzorce $R^4-CO-NH_2$, kde R^4 má význam uvedený v nároku 1, a s basí,

b) když X a Y jsou oba atomy kyslíku a R^3 a R^4 spolu dohromady se skupinou $C(O)N$ tvoří kruh obecného vzorce XIII



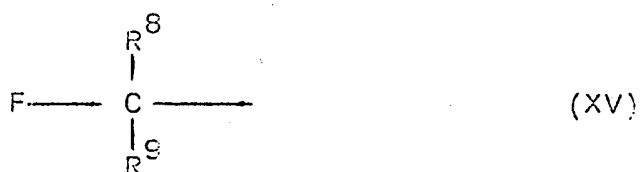
i) se nechá reagovat sloučenina obecného vzorce XIV



kde R^5 a R^6 jsou nezávisle na sobě atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo atom halo-

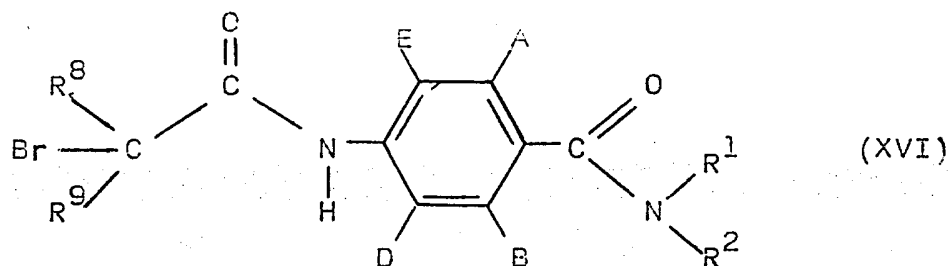
genu, X' je atom chloru, bromu nebo jodu, A, B, D, E, R^1 a R^2 mají význam uvedený v nároku 1, s basí ve dvoufázovém systému obsahujícím organické rozpouštědlo a vodu v přítomnosti katalysátoru fázového přenosu,

- c) když X a Y jsou oba atomy kyslíku, R^3 je atom vodíku a R^4 je skupina obecného vzorce XV



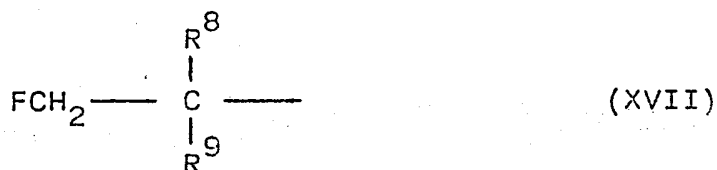
kde R^8 a R^9 jsou nezávisle na sobě atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,

- i) se nechá reagovat sloučenina obecného vzorce XVI



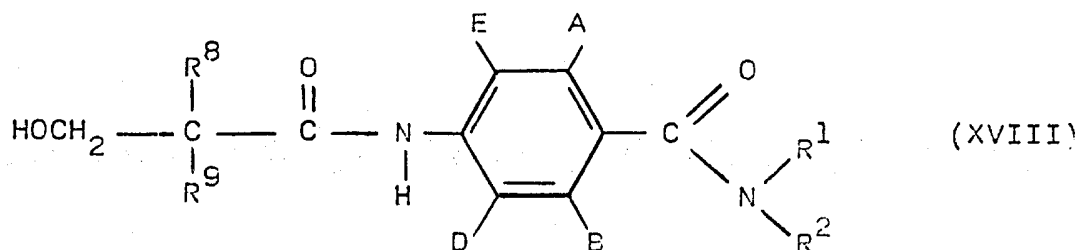
kde A, B, D, E, R^1 , R^2 mají význam uvedený v nároku 1 a R^8 a R^9 mají výše uvedený význam, s činidlem přenášejícím fluorid ve vhodném rozpouštědle,

- d) když X a Y jsou oba atomy kyslíku, R^3 je atom vodíku a R^4 je skupina obecného vzorce XVII



kde R^8 a R^9 mají výše uvedený význam,

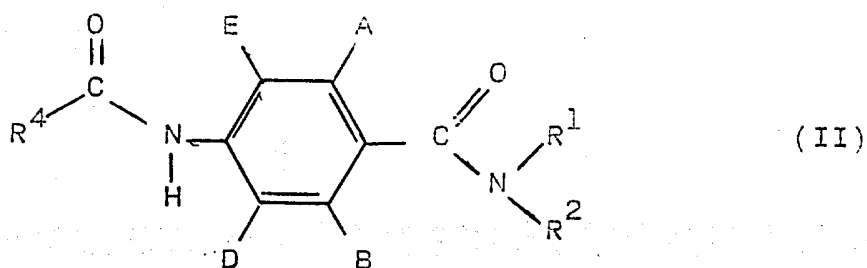
i) se nechá reagovat sloučenina obecného vzorce XVIII



kde R^8 a R^9 mají výše uvedený význam a A, B, D, E, R^1 a R^2 mají význam uvedený v nároku 1, s fluoračním činidlem ve vhodném rozpouštědle,

e) když X je atom kyslíku nebo síry, Y je atom síry a R^3 je atom vodíku,

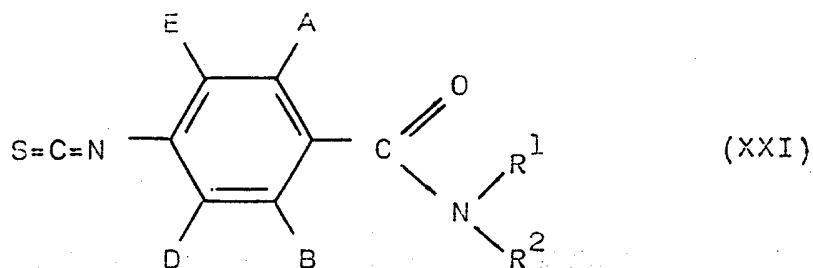
i) se nechá reagovat sloučenina obecného vzorce II



kde A, B, D, E, R^1 , R^2 mají význam uvedený v nároku 1, s thionačním činidlem ve vhodném rozpouštědle za vzniku buď sloučeniny obecného vzorce I, uvedeného v nároku 1, kde X je atom kyslíku, Y je atom síry a R^3 je atom vodíku, nebo směsi sloučeniny obecného vzorce I uvedeného v nároku 1, kde X je atom kyslíku, Y je atom síry a R^3 je atom vodíku, a sloučeniny obecného vzorce I uvedeného v nároku 1, kde X a Y jsou oba atomy síry a R^3 je atom vodíku,

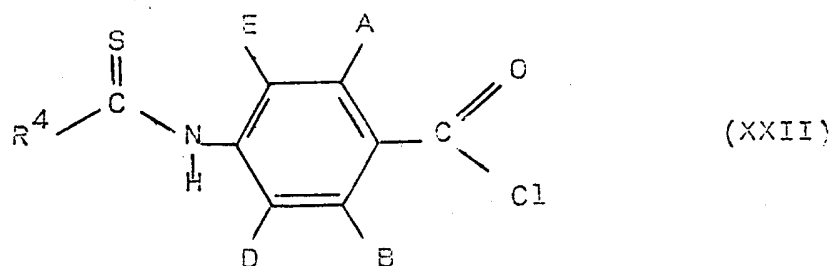
f) když X je atom síry, Y je atom kyslíku a R^3 je atom vodíku

i) se nechá reagovat isothiokyanát obecného vzorce XXI



kde A, B, D, E, R^1 a R^2 mají význam uvedený v nároku 1, s organokovovým činidlem vzorce R^4Li nebo $R^4Mg-hal$, kde R^4 má význam uvedený v nároku 1 a hal je atom halogenu, ve vhodném rozpouštědle při teplotě v rozmezí od $-78^\circ C$ do $+25^\circ C$, nebo

ii) se nechá reagovat chlorid kyseliny obecného vzorce XXII



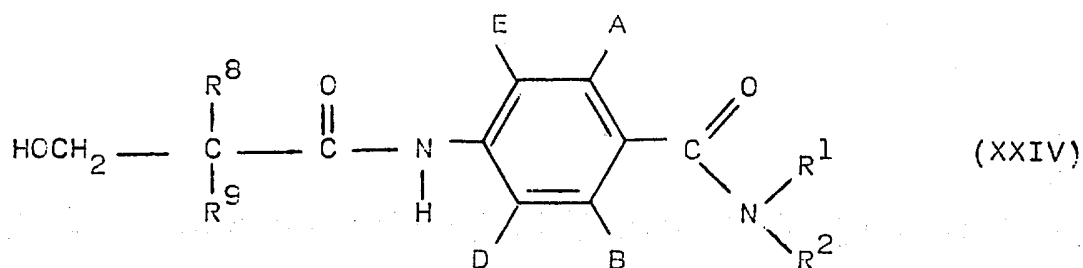
kde A, B, D, E a R^4 mají význam uvedený v nároku 1, s aminem obecného vzorce R^1R^2NH , kde R^1 a R^2 mají význam uvedený v nároku 1, v přítomnosti base, nebo

g) když X a Y jsou oba atomy kyslíku, R^3 je atom vodíku a R^4 je skupina obecného vzorce XXIII



kde R^8 a R^9 mají výše uvedený význam, a R^{11} je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,

i) se nechá reagovat sloučenina obecného vzorce XXIV



kde R^8 a R^9 mají výše uvedený význam a A, B, D, E, R^1 a R^2 mají význam uvedený v nároku 1, s halogenidem obecného vzorce $\text{R}^{11}\text{-hal}$, kde R^{11} a hal mají výše uvedený význam, ve vhodném rozpouštědle.

10. Fungicidní prostředek, vyznačený tím, že obsahuje fungicidně účinné množství sloučeniny obecného vzorce I podle nároku 1 a fungicidně přijatelný nosič nebo ředidlo.

11. Způsob potírání hub, vyznačený tím, že se na rostliny, semena rostlin nebo na místa, kde rostliny nebo semena se vyskytují, aplikuje sloučenina obecného vzorce I podle nároku 1 nebo prostředek podle nároku 10.

Zastupuje :