



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

208150

(11) (B2)

- (22) Přihlášeno 19 08 77
(21) (PV 1388-79)
(32) (31)(33) Právo přednosti od 16 11 76
(47667/76) a od 08 02 77 (5139/77)
Velká Británie
(40) Zveřejněno 28 11 80
(45) Vydáno 15 05 84

(51) Int. Cl.³
A 01 N 43/50//
A 01 N 43/64

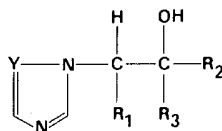
- (72) Autor vynálezu BALASUBRAMANYAN SUGAVANAM, WOKINGHAM, SHEPHARD MARGARET CLAIRE,
MAIDENHEAD, BATCH JEREMY JAMES a BOIZE LINDA MARY, SUNNINGHILL
(73) Majitel patentu (VELKÁ BRITÁNIE)
IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES LIMITED, LONDÝN (VELKÁ BRITÁNIE)

(54) Způsob přípravy triazolů a imidazolů

1

Vynález se týká způsobu přípravy heterocyklických sloučenin, konkrétně imidazolů a 1,2,4-triazolů, které jsou užitečné jako fungicidy a látky pro regulaci růstu rostlin.

Předmětem vynálezu je způsob přípravy triazolů a imidazolů obecného vzorce I



(I)

kde

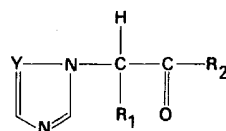
Y představuje skupinu vzorce =N- nebo =CH-,

R₁ představuje C₂₋₄ alkenylskupinu nebo benzylskupinu, popřípadě v kruhu substituovanou halogeny, trifluormetyl-, nitro-, kyano-, C₁₋₄ alkyl-, C₁₋₄ alkoxy-, C₁₋₄ alkylendioxy-, amino-, hydroxy-, fenyl- nebo fenoxyskupinami nebo/a popřípadě na alfa-atomu uhlíku substituovanou fenyl- nebo C₁₋₄ alkylskupinou,

R₂ představuje propyl- nebo butylskupinu a

R₃ představuje metyl- nebo C₂ až C₄ alkenylskupinu

a jejich adičních solí s kyselinami, vyznačený tím, že se sloučenina obecného vzorce II



(II)

kde

Y, R₁ a R₂ mají shora uvedený význam,

nebo její adiční sůl s kyselinou nechá reagovat při 15 až 80 °C se sloučeninou obecného vzorce



kde

R₃ má shora uvedený význam a

X představuje halogen.

Sloučeniny podle vynálezu obsahují chirální centra. Obvykle se sloučeniny podle vynálezu získávají ve formě racemických směsí. Tyto nebo jiné směsi lze však rozdělit na jednotlivé isomery o sobě známými způsoby, například chromatografií. V mnoha případech lze sloučeniny připravit stereospecificky ve formě jednoho diastereoisomeru.

Benzylskupina může obsahovat více než jeden substituent v kruhu. Jako příklady polysubstituovaných skupin lze uvést skupiny obsahující až do nejvyššího možného počtu substituentů (zejména obsahující 1, 2 nebo 3 substituenty), jako například atomy halogenů, zejména atomy chloru a/nebo nitro-, metyl- nebo metoxyskupiny.

Vhodnými solemi jsou soli s anorganickými nebo organickými kyselinami, například kyselinou chlorovodíkovou, dusičnou, sírovou, toluensulfonovou, octovou nebo šťavelovou.

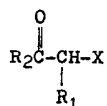
Specifické příklady sloučenin podle vynálezu jsou uvedeny v tabulce 1.

T a b u l k a 1

Číslo	R ₁	R ₂	R ₃	Y	Teplota tání nebo teplota varu (°C)
1	p-F-C ₆ H ₄ CH ₂ -	terc.Bu	Me	=N-	152 až 153
2	p-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂ -	terc.Bu	Me	=N-	176 až 178
3	2-Cl-4-F-C ₆ H ₃ CH ₂	terc.Bu	Me	=N-	153 až 154
4	o-F-C ₆ H ₄ CH ₂	terc.Bu	Me	=CH-	146 až 149
5	p-Br-C ₆ H ₄ CH ₂	terc.Bu	Me	=CH-	188 až 192

Reakce, která je podstatou způsobu podle vynálezu, se může provádět o sobě známými způsoby.

Výchozí sloučenina obecného vzorce II se může vyrobit tak, že se imidazol nebo 1,2,4-triazol nebo jeho sůl nechá reagovat s alfa-halogenketonem obecného vzorce III



(III)

kde

X představuje halogen, přednostně brom nebo chlor a

R₁ a R₂ mají shora uvedený význam.

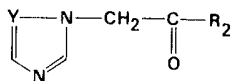
Tento způsob se může provádět tak, že se reakční složky spolu zahřívají popřípadě v přítomnosti rozpouštědla nebo ředidla. Přednostně se pracuje v přítomnosti rozpouštědla.

Vhodnými rozpouštědly jsou rozpouštědla neobsahující hydroxylové skupiny jako acetonitril, dimethylformamid, dimetylsulfoxid, sulfolan a tetrahydrofuran. Rozpouštědel obsahujících hydroxyskupiny, například metanolu a etanolu se může použít za určitých podmínek, pokud přítomnost hydroxyskupin nenarušuje průběh reakce. Postup se může provádět v přítomnosti zásady jako natriumhydridu, etoxidu sodného, přebytkového imidazolu nebo triazolu nebo uhličitanu alkalického kovu (například uhličitanu draselného). Reakční teplota závisí na volbě reakčních činidel, rozpouštědel a zásady, ale obvykle se reakční směs zahřívá k teplotě varu pod zpětným chladičem.

Obvykle se při postupu nejprve reakční složky rozpustí v rozpouštědle a produkt se po proběhnutí reakce izoluje po vakuovém odstranění reakčního rozpouštědla. Nezreagovaný imidazol nebo triazol se může odstranit extrakcí produktu vhodným rozpouštědlem, které se pak promyje vodou. Je-li to žádoucí může se pak popřípadě provést krystalizace nebo jiné přečištění.

Alfa-halogenketony se mohou vyrobit známými způsoby.

Sloučeniny obecného vzorce II nebo jejich soli se mohou rovněž připravit alkenylací, alkynylací nebo aralkylací sloučeniny obecného vzorce IV



(IV)

kde

Y a R₂ mají shora uvedený význam.

Další podrobnosti o této reakci lze najít v německé zveřejněné přihlášce vynálezu číslo 2 610 022.

Sloučeniny jsou účinnými fungicidy, zejména proti těmto chorobám:

Piricularia oryzae na rýži,

Puccinia recondita, *Puccinia striiformis* a jiné rzi na pšenici,

Puccinia hordei, *Puccinia striiformis* a jiné rzi na ječmeni a rzi na jiných hostitelských rostlinách, například na kávovníku, jabloních, zelenině a okrasných rostlinách,

Plasmopara viticola na vinné révě,

Erysiphe graminis (padlí travní) na ječmeni a pšenici a jiné padlí na různých hostitelských rostlinách, například *Sphaerotheca fuliginea* na okurkách, *Podosphaera leucotricha* na jabloních a *Uncinula necator* na révě,

Cercospora arachidicola na podzemnici olejné a jiné druhy *Cercospora* například na cukrovce, banánovníku a sóji,

Botrytis cinerea (plíseň šedá) na rajčatech, jahodníku, vinné révě a jiných hostitelských rostlinách,

Phytophthora infestans (plíseň bramborová) na rajčatech a

Venturia inaequalis (strupovitost) na jabloních.

Některé ze sloučenin podle vynálezu mají rovněž široký rozsah účinnosti proti plísním *in vitro*. Mají účinek proti různým chorobám ovoce, vyskytujících se na ovoci po sklizni (například *Penicillium digitatum* a *Penicillium italicum* na pomerančích, *Gloeosporium musarum* na banánech. Některé ze sloučenin jsou účinné jako mořidla osiva proti *Fusarium* spp., *Tilletia* spp. (choroba pšenice přenášená osivem), *Ustilago* spp., a *Pyrenophora* spp. na obilninách.

Sloučenin podle vynálezu lze rovněž používat jako průmyslových (na rozdíl od zemědělských) fungicidů, například jako fungicidů v nátěrových hmotách.

Sloučeniny podle vynálezu mají rovněž účinek na regulaci růstu rostlin.

Účinek sloučenin na regulaci růstu rostlin se projevuje například jako účinek způsobující zakrtnění vegetativního růstu jedno- nebo dvouděložných bylin nebo dřevin. Takové zakrtnění může být užitečné například u obilnin nebo sóji, kde může zkrácení stonku snížit riziko poléhání. Sloučeniny, způsobující zakrtnění růstu mohou být rovněž užitečné při modifikaci růstu cukrové třtiny, poněvadž zvyšují koncentraci cukru ve třtině při sklizni. Dosažení zakrtnění u podzemnice olejné může napomoci sklizni. Retardace růstu trav může napomoci udržování travních drnů.

Jako příklady vhodných trav lze uvést *Stenotaphrum secundatum*, *Cynosurus cristatus*, *Lolium multiflorum* a *Lolium perenne*, *Agrostis tenuis*, *Cynodon dactylon*, *Dactylis glomerata*, *Festuca* spp. (například *Festuca rubra*) a *Poa* spp. (například *Poa pratense*). Alespoň některé ze sloučenin podle vynálezu mají vliv na zakrtnění trav bez výrazného fytotoxického účinku a bez škodlivého ovlivnění vzhledu (například barvy trávy), což je činí atraktivními pro použití při udržování okrasných travníků a travnatých okrajů záhonů apod. Sloučeniny mohou rovněž způsobit zakrtnění plevelných druhů rostlin přítomných v těchto travách, jako jsou například *Cyperus* spp. a dvouděložné plevelné rostliny. Sloučeninami podle vynálezu lze rovněž retardovat růst vegetace, která není pěstována, například plevelných rostlin nebo přirozené rostlinné pokrývky, čehož lze využít při udržování plantáží nebo solí. Regulační účinek na rostliny se může projevit zvýšením úrody.

Z jiných regulačních účinků sloučenin na růst rostlin lze uvést změnu úhlu listů rostlin a podporování odnožování u jednoděložných rostlin. Změna úhlu listů může být užitečná například v případě změny orientace listů u brambor, která umožňuje, že se k pěstovaným rostlinám dostane více světla, což má za následek zvýšení fotosyntézy a hmotnosti hlíz. Zvýšením odnožování u jednoděložných plodin (například rýže) se může zvýšit počet kvetoucích výhonů na jednotku plochy, což má za následek zvýšení celkového výnosu zrna u těchto plodin. Ošetření rostlin sloučeninami podle vynálezu může vést k tomu, že barva listů rostlin má tmavší odstín zeleně.

Sloučeniny podle vynálezu mohou též inhibovat kvetení cukrovky, což se projeví zvýšením výnosu cukru. Mohou rovněž snížit velikost bulev cukrovky bez podstatného snížení výnosu cukru, což umožňuje zvýšit hustotu výsevu.

Při regulaci růstu rostlin pomocí sloučenin podle vynálezu závisí množství použité sloučeniny na řadě faktorů, například na konkrétně zvolené sloučenině a na druhu rostliny,

jejíž růst má být regulován. Obecně se však aplikuje 0,1 až 15, přednostně 0,1 až 5 kg sloučeniny na hektar. U určitých rostlin může mít však i aplikace v tomto rozmezí nežádoucí fyto toxický účinek. Pro určení optimálního množství specifické sloučeniny pro každý specifický účel, pro který je použití sloučeniny vhodné, bývá potřebné provést běžné testy.

Sloučeniny podle vynálezu mají rovněž algicidní, antibakteriální a antivirální účinek a herbicidní účinek.

Pro potlačování plísní nebo pro regulaci růstu rostlin se může používat sloučenin jako takových, ale účelně se jich používá ve formě prostředků. Prostředky obsahují sloučeninu obecného vzorce I nebo její sůl a nosič nebo ředidlo.

Sloučenin obecného vzorce I a jejich solí se může používat pro potlačování fungicidních chorob rostlin a pro regulaci růstu rostlin tak, že se na rostliny, semena rostliny nebo místo, kde jsou rostliny nebo semena umístěny aplikuje shora definovaná sloučenina podle vynálezu nebo její sůl.

Sloučeniny obecného vzorce I a jejich solí se mohou aplikovat různými způsoby, například se mohou aplikovat jako takové nebo ve formě prostředků, buď přímo na listy rostlin, nebo též přímo na křoviny a stromy nebo na semena nebo na prostředí, ve kterém rostliny, křoviny nebo stromy rostou, nebo mají být pěstovány. Sloučeniny, či prostředky se přitom mohou aplikovat jako postřiky, popraše nebo jako krémy nebo pasty nebo se mohou aplikovat ve formě par. Mohou se aplikovat na jakoukoli část rostliny, křoviny či stromu, například na listy, stonky, větve nebo kořeny nebo na půdu obklopující kořeny nebo na semena před zasetím.

Pod označením rostlina se rozumějí jak semenáčky, tak křoviny a stromy. Fungicidní účinek podle vynálezu je preventivní, ochranný, profylaktický nebo vykořeňující.

Sloučenina podle vynálezu se pro zemědělské a zahradnické účely přednostně používá ve formě prostředků. Typ použitého prostředku závisí vždy na konkrétně zamýšleném účelu.

Prostředky mohou mít podobu poprašů nebo granulátů, obsahujících účinnou složku a pevné ředidlo nebo nosič, například kaolin, bentonit, křemelinu, dolomit, uhličitán vápenatý, mastek, práškový kyseličník hořečnatý, valchářskou hlínu, sádku, Hewittovu hlínu, infusoriovou hlínu a kaolin. Prostředky pro moření osiva mohou obsahovat například látku zvyšující adhezi prostředku k semenům (například minerální olej). Alternativně se může účinná složka zpracovat na prostředek pro moření osiva pomocí organického rozpouštědla (například N-metylpiperolidonu nebo dimetylformamidu).

Prostředky mohou mít též podobu dispergovatelných prášků, granulátů nebo zrn, obsahujících smáčedlo usnadňující dispergaci prášku nebo zrn v kapalinách. Tyto prostředky mohou obsahovat též plniva a suspenzní činidla.

Vodné disperze nebo emulze se mohou připravit též tak, že se účinná složka nebo účinné složky rozpustí v organickém rozpouštědle, popřípadě obsahujícím jedno nebo více smáčedel, dispergačních činidel nebo emulgátorů a pak se ke směsi přidá voda, popřípadě obsahující smáčedla, dispergátory nebo emulgátory. Vhodnými organickými rozpouštědly jsou etylendichlorid, isopropylalkohol, propylenglykol, diacetonalkohol, toluen, petrolej, metylnaftalen, xyleny, trichloretylen, furfurylalkohol, tetrahydrofurfurylalkohol a glykol-étery (například 2-etoxyetanol a 2-butoxyetanol).

Prostředky, jichž se má používat jako postřiků mohou být též ve formě aerosolů, ve kterých se prostředek udržuje v nádobě za tlaku v přítomnosti hnacího plynu, například fluortrichlormetanu nebo difluordichlormetanu.

Sloučeniny se mohou též v suchém stavu mísit s pyrotechnickou směsí za vzniku prostředků vhodných pro tvorbu dýmu, obsahujícího sloučeniny v uzavřených prostorech.

Alternativně se může sloučenin používat ve formě mikropouzder (v mikroenkapsulované formě).

Různým použitím lze různé prostředky lépe přizpůsobit tím, že se k nim přidají vhodné přísady, například přísady pro zlepšení distribuce, adheze nebo odolnosti sloučenin vůči dešti na ošetřených površích.

Sloučenin lze používat ve formě směsí s hnojivy (například hnojivy, obsahujícími dusík, draslík nebo fosfor). Přednost se dává takovým prostředkům, které obsahují pouze granulované hnojivo, do kterých je zavedena, například povlečením sloučenina podle vynálezu. Takové granulace obsahují účelně až do 25 % hmotnostních sloučeniny.

Prostředky mohou mít rovněž podobu kapalných přípravků, kterých se používá jako máčečecích lázní nebo postřiků. Takovými prostředky jsou obvykle vodné disperze nebo emulze, obsahující účinnou složku v přítomnosti jednoho nebo více smáčedel, dispergátorů, emulgátorů nebo suspenzních činidel. Těmito činidly mohou být kationtové, aniontové nebo neiontové činidla. Vhodnými kationtovými činidly jsou kvartérní amoniové sloučeniny, například cetyltrimetylamoniumbromid.

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

Vhodnými neiontovými činidly jsou kondenzační produkty etylenoxidu s mastnými alkoholy jako s oetyl- nebo cetylalkoholem nebo s alkylfenoly jako je oktyl- nebo nonylfenol a oktylkresol. Jinými neiontovými činidly jsou částečné estery odvozené od mastných kyselin s dlouhým řetězcem a anhydridů hexitu, kondenzační produkty těchto parciálních esterů s etylenoxidem a lecithiny. Vhodnými suspenzními činidly jsou hydrofilní koloidy (například polyvinylpyrrolidon a sodná sůl karboxymethylcelulózy) a pryskyřice rostlinného původu (například arabská guma a tragant).

Prostředky určené pro použití ve formě vodných disperzí nebo emulzí se obvykle dodávají ve formě koncentrátů obsahujícího vysoký podíl účinné sloučeniny nebo sloučenin, přičemž koncentrát se pak před použitím ředí vodou. Tyto koncentráty vydrží často dlouhodobé skladování a po takovém skladování je lze zředit vodou za vzniku vodných prostředků, které jsou homogenní po dobu postačující pro to, aby je bylo možno aplikovat pomocí běžného postřikovacího zařízení. Koncentráty obsahují účelně až 95 %, s výhodou 10 až 25 %, například 25 až 60 % hmotnostních účinné složky nebo složek. Po zředění vodou na vodné prostředky mohou výsledné prostředky obsahovat různé množství účinné složky nebo složek, v závislosti na zamýšleném účelu použití. Obvykle se však používá vodných prostředků obsahujících 0,0005 nebo 0,01 až 10 % hmotnostních účinné složky nebo složek.

Prostředky podle vynálezu mohou obsahovat též jiné sloučeniny, které mají biologický účinek (například jiné látky stimulující růst jako jsou gibberelliny (například GA₃, GA₄ nebo GA₇), auxiny (například kyselinu indolactovou nebo indolmáslnou) a cytokininy (například kinetin, difenylmočovinu, benzimidazol a benzyladenin) a jiné sloučeniny s komplementárním fungicidním nebo insekticidním účinkem a stabilizátory, například epoxidové sloučeniny (například epichlorhydrin). Jako jiné fungicidní sloučeniny se může použít sloučeniny, která je schopna potlačovat choroby klasů u obilnin, například pšenice jako je Septoria, Gibberella, Helminthosporium a černá plíseň. Jako příklady takových sloučenin lze uvést benomyl, karbendazol (BCM) a kaptafol.

Alternativně může být takovou sloučeninou sloučenina, která je schopna potlačovat choroby přenášené osivem nebo půdou. Jako příklady takových sloučenin lze uvést Maneb a Captan.

Následující příklady slouží k bližší ilustraci vynálezu. Teplota je udávána ve °C.

Produkty označené v příkladech firemními názvy mají tuto strukturu:

Tween 20: povrchově aktivní látka na bázi kondenzátu sorbitan monolaurátu s etylenoxidu
 Aerosol OT: dioktylsulfosukcinát sodný
 Polyfon H: ligninsulfonát sodný
 Dispersol T: směs síranu sodného a kondenzátu formaldehydu se sodnou solí naftalensulfonové kyseliny.

P ř í k l a d 1

1-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-p-fluorbenzyl-2-terc.butylpropan-2-ol (sloučenina 1)

Éterický roztok metylmagnesiumjodidu (připraveného reakcí metyljodidu /6,2 g/ s hořčíkem /1,1 g/ v suchém dietyléteru) se nechá po kapkách reagovat s alfa-1,2,4-triazol-1-yl-alfa-p-fluorbenzylpinakolonem (4,0 g) v suchém dietyléteru (30 ml). Směs se pak 1 hodinu vaří pod zpětným chladičem, ochladí a působí se na ni 10% kyselinou sírovou (20 ml). Nerozpustná látka se odfiltruje, promyje zředěnou kyselinou chlorovodíkovou a vodou a pak vysuší. Po krystalizaci z vodného etanolu se získá titulní sloučenina.

P ř í k l a d 2

V tomto příkladě je uvedeno několik prostředků podle vynálezu.

1. Dispergovatelný prášek

sloučenina 1	50 % hmotnostních
aerosol OT	2 % hmotnostní
Polyfon H	5 % hmotnostních
kaolin	43 % hmotnostních

2. Emulgovatelný koncentrát

sloučenina 1	100 g/litr
dodecylbenzensulfonát aminu	400 g/litr
2-n-butoxyetanol	do 1 litru

3. Vodná suspenze

sloučenina 1	250 g/litr
Polyfon H	25 g/litr
bentonit	15
polysacharid	0,75
voda	do 1 litru

4. Popraš

sloučenina 1	5 % hmotnostních
kaolin	95 % hmotnostních

5. Granulát

sloučenina 1	5 % hmotnostních
škrob	5 % hmotnostních
kaolin	90 % hmotnostních

6. Roztok v rozpouštědle

sloučenina 1	200 g/litr
dimethylformamid	do 1 litru

P ř í k l a d 3

Sloučeniny se zkouší proti různým foliárním plísňovým onemocněním rostlin. Používá se této techniky zkoušení.

Rostliny se pěstují v kořenáčovém kompostu John Innes (č. 1 nebo "Seed" podle potřeby) v minikořenáčích o průměru 4 cm. Na dno kořenáčů se umístí vrstva jemného písku, aby se usnadnilo přijímání zkoušené sloučeniny kořeny.

Zkoušené sloučeniny se zpracují na prostředek buď tak, že se v kulovém mlýně rozemelou s vodným Dispersolem T nebo se rozpustí ve směsi aceton/etanol a vzniklý roztok se zředí na požadovanou koncentraci těsně před použitím. U foliárních chorob se na listy nastříká suspenze o koncentraci účinné látky 100 ppm a ke kořenům stejné rostliny se zavede tato suspenze prostřednictvím půdy. (Postřik se aplikuje do maximální zádrže a zálivka ke kořenům do konečné koncentrace odpovídající asi 40 ppm účinné látky vztaženo na suchou půdu.) Před aplikací postřiku na obiloviny se k prostředku přidá Tween 20 až do výsledné koncentrace 0,1 %.

Při většině testů se testovaná sloučenina aplikuje na půdu (kořeny) a na listy (postřikem) jeden nebo dva dny před inokulací rostlin chorobami. Výjimkou je test s *Erysiphe graminis*, při kterém se rostliny inokulují 24 hodin před ošetřením. Po inokulaci se rostliny umístí do vhodného prostředí, které umožňuje, aby infekce propukla a pak se provádí inkubace tak dlouho, až lze provést vyhodnocení choroby. Období mezi inokulací a hodnocením kolísá od 4 do 14 dnů v závislosti na chorobě a prostředí.

Potlačení choroby se charakterizuje následujícími stupni

- 4 = žádná choroba
- 3 = 0 až 5 %
- 2 = 6 až 25 %
- 1 = 26 až 60 %
- 0 = více než 60 %.

Výsledky jsou uvedeny v tabulce 2.

T a b u l k a 2

Slou- čenina číslo.	P o t l a č e n í c h o r o b y						
	<i>Puccinia recondita</i> na pšenici	<i>Phytophthora infestans</i> na rajčatech	<i>Plasmopara viticola</i> na révě	<i>Piricularia oryzae</i> na rýži	<i>Cercospora arachidicola</i> na podzemní- ci olejné	<i>Botrytis cinerea</i> na raj- čatech	<i>Erysiphe graminis</i> na ječmeni
1	4	0	0	3		0	4
2	2	0	3	0		1 až 2	4
3	1 až 2	2 až 3	0	0		1 až 2	3
4	0 až 1	0 až 1		0		3	4 až 3
5	0 až 3	0		0		3 až 4	4 až 3

P ř í k l a d 4

Tento příklad ilustruje ochranný účinek sloučenin (při koncentraci 50 ppm) proti různým chorobám ovoce.

Určuje se účinnost sloučenin proti padlí jabloněvému (*Podosphaera leucotricha*) a padlí révévému (*Uncinula necator*). Při zkouškách se postupuje takto:

Malé rostliny jabloně (Jonathan) a vinné révy asi 3 týdny staré pěstované v malých kořenáčích o průměru 3 cm se nejprve postříkají roztokem nebo suspenzí zkoušené sloučeniny, povlak se nechá zaschnout přes noc ve skleníku a následující den se provede infekce sporami choroby tak, že se rostliny umístí do uzavřeného prostoru a spory choroby nafoukají do tohoto prostoru se nechají bez použití proudění během 4 až 6 hodin usadit na rostlinách.

Percentuální napadení listů rostlin chorobou se provádí u jabloní po 8 dnech a u vinné révy po 9 až 10 dnech.

Dále se provedou testy účinnosti sloučenin proti strupovitosti jabloní (*Venturia inaequalis*). Tyto testy se provádějí takto:

Spory *Venturia inaequalis*, jakožto obligátního parazitu, se přenesou z rostliny na rostlinu pomocí agarové kultury, která zajišťuje vysoce patogenní plíseň.

Infikované listy se odstraní ze "zásobníků" zamořených rostlin 13 dnů před inokulací. Spory se odstraní z listů rozmícháním v malém objemu deionizované vody, spočítají se a pak se jejich počet upraví na 100 000 spor/ml. Suspenze se nastříká na spodní listy semenáčků jabloně jednoho ze tří susceptibilních druhů, tj. druhu Jonathan, Granny Smith a Red Delicious. Inokulované semenáčky se ihned umístí v prostoru s vysokou vlhkostí a teplotou 19 °C a ponechají se tam 48 hodin. Po této inkubační době se rostliny umístí v prostoru vhodném pro růst, kde se nechá vyvinout choroba. Choroba se snadno vyhodnocuje 12 nebo 13 dnů po inkubaci.

Zkoušená sloučenina se aplikuje 24 hodin po inkubaci.

Používá se stejného systému hodnocení jako v tabulce 2. Výsledky jsou uvedeny v tabulce 3.

T a b u l k a 3

Sloučenina číslo	P o t l a č e n í c h o r o b y		
	<i>Podosphaera leucotricha</i> na jabloních	<i>Uncinula necator</i> na vinné révě	<i>Venturia inaequalis</i> na jabloních
1	0	4	
2	0	2	
3	1	0	0

P ř í k l a d 5

Tento příklad ilustruje regulační účinek sloučenin na růst rostlin. Sloučeniny se aplikují ve formě roztoku v destilované vodě o koncentraci 5 000 ppm a roztok se aplikuje na listy mladých semenáčků pšenice, ječmene, kukuřice, rýže, jílku mnohokvětého, sóji, bavlní-

ku, podzemnice olejné, hlávkového salátu, rajčat, fazolu zlatého a fazolu obecného. Pokusy se opakují dvakrát. 21 dnů po ošetření se u rostlin hodnotí regulační účinek sloučenin na růst a fytotoxické symptomy.

Tabulka 4 ukazuje účinek sloučenin na zakrnění vegetativního růstu rostlin. Používá se tohoto klasifikačního systému.

- 0 = $\leq$ 20 % retardace
 1 = 21 až 40 % retardace
 2 = 41 až 60 % retardace
 3 = 61 až 80 % retardace

Pokud není uvedeno žádné číslo, je sloučenina v podstatě neúčinná jako činidlo pro dosažení zakrnělého růstu.

Další vlastnosti na regulaci růstu rostlin jsou označeny takto:

- G = tmavší zelená barva listů,
 A = vrcholový účinek,
 T = účinek na odnožování.

Symbol "-" znamená, že sloučeniny nebylo použito při zkoušení u určité plodiny.

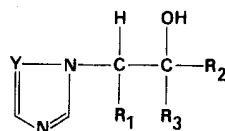
Hvězdička (+) znamená, že se sloučenina aplikuje v koncentraci 4 000 ppm.

T a b u l k a 4

Sloučenina	pšenice	ječmen	kukurice	ryže	jílek mnohokvětý	sója	bavlník	podzemnice olejná	hlávkový salát	rajče	fazol zlatý	fazol obecný
1												
2						2GA	1	-	A	0	1A	
3 +					-	2GA	2A		A	2G	-	

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Způsob přípravy triazolů a imidazolů obecného vzorce I



(I)

kde

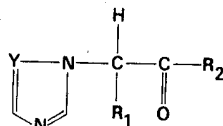
Y představuje skupinu vzorce =N- nebo =CH-,

R_1 představuje C_{2-4} alkenylskupinu nebo benzylskupinu, popřípadě v kruhu substituovanou halogeny, trifluormetyl-, nitro-, kyano-, C_{1-4} alkyl-, C_{1-4} alkoxy-, C_{1-4} alkylendioxy-, amino-, hydroxy-, fenyl- nebo fenoxyskupinami nebo/a popřípadě na alfa-atomu uhlíku substituovanou fenyl- nebo C_{1-4} alkylskupinou,

R_2 představuje propyl- nebo butylskupinu a

R_3 představuje metyl- nebo C_2 až C_4 alkenylskupinu

a jejich adičních solí s kyselinami, vyznačený tím, že se sloučenina obecného vzorce II



(II)

kde

Y , R_1 a R_2 mají shora uvedený význam,

nebo její adiční sůl s kyselinou nechá reagovat při 15 až 80 °C se sloučeninou obecného vzorce



kde

R_3 má shora uvedený význam a

X představuje halogen.

2. Způsob podle bodu 1 pro přípravu sloučenin obecného vzorce I, kde R_3 představuje metylskupinu a Y , R_1 a R_2 mají význam uvedený v bodě 1, vyznačený tím, že se jako sloučeniny obecného vzorce II použije sloučeniny, ve které Y má význam uvedený v bodě 1, R_1 představuje benzylskupinu, popřípadě v kruhu substituovanou halogeny, C_{1-4} alkyl-, nitro-, trifluormetyl-, kyan-, C_{1-4} alkoxy- nebo (C_{1-4} alkylendioxy)skupinami nebo/a popřípadě na alfa-atomu uhlíku substituovanou jednou fenyl- nebo C_{1-4} alkylskupinou a R_2 má význam uvedený v bodě 1, nebo její soli a jako sloučeniny obecného vzorce R_3MgX metylmagnesiumhalogenidu.

3. Způsob podle bodu 1 pro přípravu sloučenin obecného vzorce I, kde R_3 představuje metylskupinu a Y , R_1 a R_2 mají význam uvedený v bodě 1, vyznačený tím, že se jako sloučeniny obecného vzorce II použije sloučeniny, ve které Y má význam uvedený v bodě 1, R_1 představuje benzylskupinu, popřípadě v kruhu substituovanou halogeny, C_{1-4} alkyl-, nitro-, trifluormetyl-, kyan-, C_{1-4} alkoxy- nebo (C_{1-4} alkylendioxy)skupinami nebo/a popřípadě substituovanou na alfa-atomu uhlíku jednou C_{1-4} alkylskupinou a R_2 má význam uvedený v bodě 1, nebo její soli a jako sloučeniny obecného vzorce R_3MgX metylmagnesiumhalogenidu.