



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

230597

(11) (B2)

(22) Přihlášeno 03 12 82
(21) (PV 8746-82)

(32) (31)(33) Právo přednosti od 04 12 81
(P 31 48 742.4)
Německá spolková republika

(40) Zveřejněno 30 12 83

(45) Vydáno 15 05 86

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

(72) Autor vynálezu

SKÖTSCH CARLO dr., BAUMERT DIETRICH dr., KRÄHMER HANSJÖRG dr.,
ARNDT FRIEDRICH dr., ZÁPADNÍ BERLÍN (Západní Berlín)

(73) Majitel patentu

SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT, ZÁPADNÍ BERLÍN (Západní Berlín)

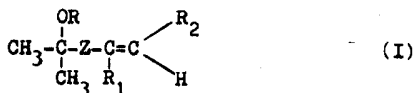
(54) Prostředek s fungicidním a herbicidním účinkem a účinkem regulujícím
růst rostlin

Vynález se týká prostředků s fungicidním a herbicidním účinkem a účinkem regulujícím
růst rostlin, stejně jako způsobu výroby účinné látky, kterou obsahují tyto prostředky.

Geometrické isomery triazolových sloučenin a prostředky, které obsahují tyto sloučeniny s fungicidním, herbicidním a/nebo růstově regulačním účinkem u rostlin jsou již známy (DE-OS 30 10 560). Tyto sloučeniny mohou být sice použity i k potlačení růstu cenných rostlin; ukázalo se však, že jejich účinek především u leguminóz a bavlny není dostatečný.

Tento vynález se týká nových prostředků, které mají všestrannější použití a které zvláště u leguminóz a bavlny vykazují značný účinek na regulaci růstu.

Prostředek s fungicidním a herbicidním účinkem a účinkem regulujícím růst rostlin podle vynálezu jako účinnou látku obsahuje azolytpentenový derivát obecného vzorce I



kde

R znamená alkyl s 1 až 4 atomy uhlíku,

R₁ znamená 1-imidazolyl nebo 1,2,4-triazol-1-yl,

R₂ znamená fenyl, methylfenyl, methoxyfenyl, halogenfenyl, dichlorfenyl, nitrofenyl, naftyl, pyridyl, furyl nebo thienyl a

Z znamená skupinu vzorce $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ -\text{C}- \end{array}$ nebo $\begin{array}{c} \text{OH} \\ | \\ -\text{CH}- \end{array}$.

230597

Sloučeniny používané podle vynálezu vykazují biocidní účinek v nejširším smyslu, přičemž jejich účinek na regulaci růstu převyšuje značně účinek známých účinných látek analogického složení.

Vzhledem k tomu, že sloučeniny podle vynálezu vyvolávají kvalitativní a kvantitativní změny u rostlin, náleží do třídy regulátorů růstu rostlin, které se vyznačují těmito možnostmi použití:

Potlačení vegetativního růstu u dřevin a zelených rostlin, například na okrajích silnic, v kelařských a podobně, k zabránění bujného vzrůstu. Potlačování vzrůstu obilí k zabránění poléhání a poruchám stébel, u bavlníku ke zvýšení výnosu.

Ovlivňování větvení vegetativních a generativních orgánů u okrasných a kulturních rostlin za účelem zvýšení nasazení květu nebo k potlačení odnožování, jako v případě tabáku a rajčat.

Zlepšení kvality plodu, například zvýšení cukernatosti u cukrové třtiny, cukrové řepy nebo ovoce a dosažení rovnoměrného dozrávání plodů, vedoucí k vyšším výnosům.

Zlepšení odolnosti rostlin vůči klimatickým vlivům, jako je chlad a sucho.

Ovlivnění vytékání latexu u gumovníků.

Vytváření partenokarpních plodů, pylové sterility a ovlivňování pohlaví náleží dále mezi oblasti použití sloučeniny podle vynálezu.

Kontrola klíčivosti semen nebo tvorby pupenů.

Ovlivňování uvolňování nebo padání plodů k usnadnění sklizně.

Sloučeniny podle vynálezu projevují svůj účinek při pre- i postemergentním použití. Jejich účinek je systemický. Tyto sloučeniny jsou vhodné zvláště k ovlivnění vegetativního a generativního růstu u leguminóz, jako je například sója.

Doba použití se mění v závislosti na účelu a klimatických podmínkách. Podle druhu rostliny a použitého množství je možno docílit různých herbicidních účinků. Množství účinné látky se podle účelu pohybuje v rozmezí od 0,005 do 5 kg účinné látky na hektar, přičemž jsou možné i vyšší dávky.

Sloučeniny podle vynálezu jsou překvapivě vhodné i ke zvýšení stresové odolnosti u kulturních rostlin, jako je bavlna, keříkové fazole, okurky, kukuřice, sója a jiné. Zvláště významné je zvýšení odolnosti vůči usychání. Tento účinek je důležitý zvláště v pěstelských oblastech, kde je nutno mnohé kultury uměle zavlažovat při velké spotřebě energie. Odhaduje se, že v roce 2000 bude pod závlahou přibližně 200 miliónů hektarů půdy.

Úprava rostlin v tom smyslu, že budou vyžadovat méně vody, nebo že překonají bez závlahy několik dnů sucha, znamená značné pracovní i materiální úspory a zabránění škodám. Kromě toho mohly být obdělávány plochy, které nemohly být z hlediska nedostatečné vláhy využívány.

Fungicidní účinek proti houbám má překvapivě široké spektrum. Při ošetření nadzemních částí rostlin zajišťuje ochranu proti původcům houbové poléhavosti. Proti původcům přenosných chorob semen se mohou sloučeniny podle vynálezu použít při ošetření osiva.

Kromě toho působí tyto sloučeniny systemicky, to znamená, že při zapravení do půdy během setí jsou přijmuty kořeny a transportovány k nadzemní části rostliny, kde působí proti původci choroby.

Sloučeniny podle vynálezu vykazují kromě toho rovněž baktericidní účinek. Vzhledem ke zjištěnému širokému spektru účinnosti se sloučeniny hodí nejen k ochraně kulturních rostlin nýbrž současně k materiální ochraně a boji proti patogenním mikrobům člověka a zvířat, z čehož vyplývají široké možnosti použití.

Základní oblastí použití sloučeniny podle vynálezu jsou dány významem substituentů, určujících účinek konečných sloučenin. Tak mohou být tyto sloučeniny použity jako regulátory růstu rostlin, fungicidy nebo baktericidy.

Ve sloučeninách obecného vzorce I mohou mít substituenty například tento význam:

- R alkyl s 1 až 4 atomy uhlíku, například methyl, ethyl, propyl a butyl,
 R₁ 1-imidazolyl nebo 1,2,4-triazol-1-yl,
 R₂ fenyl, 2-fluorfenyl, 3-fluorfenyl, 4-fluorfenyl, 2-chlorfenyl, 3-chlorfenyl, 4-chlorfenyl, 2-bromfenyl, 3-bromfenyl, 4-bromfenyl, 2-jodfenyl, 3-jodfenyl, 4-jodfenyl, 2,3-dichlorfenyl, 2,4-dichlorfenyl, 3,4-dichlorfenyl, 2,6-dichlorfenyl, 2-methylfenyl, 3-methylfenyl, 4-methylfenyl, 2-methoxyfenyl, 4-methoxyfenyl, 2-nitrofenyl, 3-nitrofenyl, 4-nitrofenyl, 5-nitrofenyl, naftyl, pyridyl, thienyl, furyl a
 Z značí skupinu -CO- nebo -CH(OH).

Pro tvorbu adičních solí s kyselinami přicházejí v úvahu anorganické nebo organické kyseliny, příkladně je možno jmenovat: kyseliny halogenovodíkové, jako je například kyselina chlorovodíková a kyselina bromovodíková, dále kyselina fosforečná, kyselina sírová, kyselina dusičná, mono- a bifunkční kyseliny uhličitě a uhlovodíkové, jako je například kyselina octová, kyselina maleinová, kyselina oxalová, kyselina jantarová, kyselina fumarová, kyselina vinná, kyselina citronová, kyselina salicylová, kyselina mléčná, stejně jako sulfonové kyseliny, jako je například kyselina p-toluensulfonová a 1,5-naftalendisulfonová.

Tyto adiční soli s kyselinami mohou být připraveny podle některého ze známých postupů pro výrobu solí, například rozpouštěním sloučeniny obecného vzorce I ve vhodném rozpouštědle a přidáním kyseliny.

Vynikající účinky na regulaci růstu vykazují zvláště následující sloučeniny:

1-(2,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on,
 1-(2,6-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on,
 4-methoxy-4-methyl-1-fenyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on,
 1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol,
 1-(2,4-dichlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on,
 1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on.

Následující sloučeniny podle vynálezu vykazují významný fungicidní účinek:

1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on,
 1-(2-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on,
 1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol,
 1-(2,4-dichlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on,
 4-methoxy-4-methyl-1-fenyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on.

Jak již bylo uvedeno, jsou sloučeniny podle vynálezu přiváděny do rostliny systemicky. Z toho vyplývá, že účinkují jako regulátory růstu při aplikaci do půdy, stejně jako při postřiku. Zvláště vynikající účinek na otláčení růstu vykazují sloučeniny podle vynálezu u leguminóz a bavlny.

Sloučeniny podle vynálezu vykazují kromě uvedených účinků rovněž baktericidní a herbicidní účinek, které umožňují další možnosti využití.

Sloučeniny podle vynálezu mohou být použity samotné, ve vzájemné směsi nebo ve směsi s jinými účinnými látkami. Popřípadě mohou být přidány jiné ochranné prostředky v závislosti na účelu použití.

Účelně se uvedené účinné látky používají ve formě přípravků, jako jsou prášky, zásypy, granuláty, roztoky, emulze nebo suspenze, za přídavku kapalných a/nebo pevných nosičů, popřípadě ředidel a dále zesíťovačů, lepidel, emulgátorů a/nebo dispergačních činidel. Stejně závěry platí pro směsi účinných látek.

Vhodným kapalným nosičem je například voda, alifatické a aromatické uhlovodíky, jako je benzen, toluen, xylen, cyklohexanon, isoforon, dimethylsulfoxid, dimethylformamid, dále frakce minerálních olejů a rostlinné oleje.

Ve formě pevných nosičů jsou vhodné minerální zeminy, jako je například tonsil, silika-gel, mastek, kaolin, attapulgit, vápenec, kyselina křemičitá a rostlinné produkty, jako je například moučka.

Jako povrchově aktivní látky je možno jmenovat: například ligninsulfonát vápenatý, polyoxyethylenalkylfenylether, kyseliny naftalensulfonové a jejich soli, kyseliny fenol-sulfonové a jejich soli, kondenzační produkty formaldehydu, sulfáty mastných alkoholů a substituované benzensulfonové kyseliny a jejich soli.

Pokud se účinné látky použijí k moření osiva, mohou být přimísena rovněž barviva, za účelem zřetelného barevného označení mořeného osiva.

Podíl účinné látky nebo účinných látek v různých přípravcích se pohybuje v širokém rozmezí. Tak může prostředek obsahovat asi 10 až 90 hmotnostních procent účinné látky, asi 90 až 10 hmotnostních procent kapalného nebo pevného nosiče a dále případně do 20 hmotnostních procent povrchově aktivní látky.

Aplikace prostředku může být provedena obvyklým způsobem, například při použití vody jako nosiče v dávce 100 až 1 000 litrů postřiku na hektar. Použití prostředku v tak zvaných "Low-Volume-" nebo "Ultra-Low-Volume" dávkách je rovněž možné, stejně jako jeho aplikace ve formě tak zvaných mikrogranulí.

K přípravě přípravku se použijí například následující přísady:

A. Popraš

- a) 40 hmotnostních procent účinné látky
 - 25 hmotnostních procent jílovitých minerálií
 - 20 hmotnostních procent kyseliny křemičitě
 - 10 hmotnostních procent živice
 - 5 hmotnostních procent povrchově aktivní látky na bázi směsi vápenaté soli kyseliny ligninsulfonové s alkylfenolpolyglykolethery
- b) 25 hmotnostních procent účinné látky
 - 60 hmotnostních procent kaolinu
 - 10 hmotnostních procent kyseliny křemičitě
 - 5 hmotnostních procent povrchově aktivní látky na bázi sodné soli N-methyl-N-oleyl-taurinu a vápenaté soli kyseliny ligninsulfonové
- c) 10 hmotnostních procent účinné látky
 - 60 hmotnostních procent jílovitých minerálií
 - 15 hmotnostních procent kyseliny křemičitě
 - 10 hmotnostních procent živice

5 hmotnostních procent povrchově aktivní látky na bázi sodné soli N-methyl-N-oleyl-taurinu a vápenaté soli kyseliny ligninsulfonové

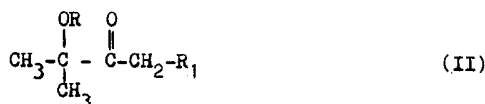
B. Pasta

- 45 hmotnostních procent účinné látky
- 5 hmotnostních procent křemičitanu hlinito-sodného
- 15 hmotnostních procent cetylpolglykoletheru s 8 mol ethylenoxidu
- 2 hmotnostní procenta kukuřičného oleje
- 10 hmotnostních procent polyethylenglykolu
- 23 dílů vody

C. Emulzní koncentrát

- 25 hmotnostních procent účinné látky
- 15 hmotnostních procent cyklohexanonu
- 55 hmotnostních procent xylenu
- 5 hmotnostních procent směsi nonylfenylpolyoxyethylenu nebo dodecylbenzolsulfonátu vápenatého.

Účinná látka prostředků podle vynálezu se připraví tím, že se nechá reagovat sloučenina obecného vzorce II



kde

R a R₁ mají výše uvedený význam,

se sloučeninou obecného vzorce III



kde

R₂ má výše uvedený význam,

které jsou popřípadě rozpouštěné v rozpouštědle, za přítomnosti katalyzátoru a získaný reakční produkt se Z ve významu -CO- se případně redukuje na sloučeninu Z ve významu -CH(OH)-.

Kondenzace se provádí o sobě známými postupy. Obecně se ponechají reagovat 1 mol 3-alkoxy-1-(azol-1-yl)-3-methyl-2-butanonu obecného vzorce II s 1 až 2 moly aldehydu obecného vzorce III případně při použití vhodného rozpouštědla a v přítomnosti katalyzátoru. Katalyzátorem může být například hydroxid alkalického kovu, nebo hydroxid alkalické zeminy, jako je hydroxid sodný, draselný nebo vápenatý, alkoholát alkalického kovu, jako je methylát sodný, ethylát sodný nebo methylát draselný, uhličitán, například uhličitán sodný nebo draselný, octan, například octan sodný, nebo draselný, sekundární amin, například diethylamin, dipropylamin, pyrrolidin, piperidin, nebo morfolin, nebo terciární amin, jako je triethylamin, tributylamin, pyridin, pikolin, nebo dimethylanilin. Katalyzátor se používá v množství 0,5 až 1,0 mol.

Použitelnými rozpouštědly jsou například alkoholy, jako je methanol nebo ethanol, aromatické uhlovodíky, jako je benzen, toluen, nebo xylén, ethery, například diethylether, tetrahydrofuran, nebo dioxan, voda a směsi těchto látek. Reakce probíhá účelně v teplotním rozmezí od 0 °C do teploty varu příslušného rozpouštědla.

V případě, že se jako katalyzátoru použije octanu, například octanu sodného nebo draselného, uhličitanu, například uhličitanu sodného nebo draselného nebo terciárního amínu, může se jako reakční rozpouštědlo použít kyselina octová nebo anhydrid kyseliny octové.

Čištění sloučenin probíhá obecně rekrystalizací nebo sloupcovou chromatografií.

Ke sloučeninám obecného vzorce I se Z výhradně ve významu skupina $-\text{CH}(\text{OH})-$, 4-alkoxy-1-aryl-2-(azol-1-yl)-4-methyl-1-penten-3-ol, se dojde redukcí odpovídajících on-sloučenin obecného vzorce I se $Z = -\text{CO}-$. Za tím účelem se použije ve vhodném rozpouštědle komplex kovu, například hydrid lithnohlinitý nebo natriumborhydrid nebo alkoxid hlinitý, například isopropylát hlinitý.

Jako rozpouštědlo se při redukcí s hydridem lithno-hlinitým hodí například ether, jako je diethylether nebo tetrahydrofuran. Reakční teplota se pohybuje v rozmezí od -20°C do $+60^\circ\text{C}$.

Při použití natriumborhydridu se jako rozpouštědlo hodí zvláště ether, jako je diethylether, nebo tetrahydrofuran, alkohol, jako je methanol, ethanol nebo isopropanol. Reakční teplota se pohybuje v rozmezí od 0°C do teploty okolí.

Pokud se jako redukční činidlo použije isopropylát hlinitý, je výhodné použít jako rozpouštědla alkoholu, jako je isopropanol nebo aromatického uhlovodíku, jako je toluen.

Čištění sloučenin probíhá pomocí rekrystalizace nebo sloupcové chromatografie.

Následující příklady slouží k bližšímu objasnění způsobu podle vynálezu.

P ř í k l a d 1

1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on

26,8 g (0,146 mol) 3-methoxy-3-methyl-1-(1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanonu se ponechá reagovat s 21,38 g (0,152 mol) 4-chlorbenzaldehydu v 85 ml anhydridu kyseliny octové. Po zahřátí na 50°C se přikape 20 ml triethylaminu. Následně se reakční směs míchá 4,5 hodiny při 70°C , ponechá v klidu přes noc a odpaří do sucha ve vakuové rotační odparce.

Odparek s vyjme v 500 ml ethylesteru kyseliny octové, promyje 2krát vždy 300 ml zředěného roztoku kyselého uhličitanu draselného a následně 2krát vodou. Organická fáze se vysuší síranem hořečnatým a po přefiltrování zahustí ve vakuové rotační odparce. Získaný tmavě žlutý olej krystalizuje po přidavku hexanu. Produkt se rekrystalizuje z diisopropyletheru.

Výtěžek: 21 g (47 % teorie)
Teplota tání: 102°C .

P ř í k l a d 2

1-(2-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol

10 g (0,0327 mol) 1-(2-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-onu se rozpustí v 25 ml methanolu. Při 0 až 10°C se za míchání přidává během 15 minut 0,57 g (0,015 mol) natriumborhydridu. Reakční směs se domíchá 1 hodinu ve vakuu, smísí s kyselinou octovou a roztok se zalkalizuje roztokem K_2CO_3 . Směs se extrahuje esterem kyseliny octové, octanová fáze se vysuší MgSO_4 , přefiltruje, odstředí a odparek rekrystalizuje z diisopropyletheru.

Výtěžek: 5,2 g = 51,7 % teorie.
Teplota tání: 116 až 118 °C.

Analogickým způsobem je možno připravit následující sloučeniny:

Název sloučeniny	Fyzikální konstanty
1-(2-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	(T. t. = teplota tání) t. t.: 95 až 98 °C
1-(2,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 89 až 91 °C
1-(2,6-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 100 až 103 °C
4-methoxy-4-methyl-1-fenyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 76 až 80 °C
1-(4-chlorfenyl)-2-imidasol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	t. t.: 70 až 73 °C
4-methoxy-4-methyl-1-(2-thienyl)-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t. 94 až 97 °C
2-imidasol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-(2-thienyl)-1-penten-3-on	t. t.: 72 až 76 °C
1-(2,4-dichlorfenyl)-2-(imidasol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	t. t.: 105 až 108 °C
1-(2,5-dichlorfenyl)-2-(imidasol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	t. t. 97 až 99 °C
1-(2-chlorfenyl)-2-imidasol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	t. t. 72 až 75 °C
2-(imidasol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-fenyl-1-penten-3-on	t. t.: 67 až 70 °C
1-(2,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 175 až 177 °C
1-(3,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on, naftalendisulfonát	t. t.: 227 až 32 °C
1-(2,6-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 128 až 30 °C
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 126 °C
4-methoxy-4-methyl-1-(2-thienyl)-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t. 131 až 136 °C
1-(4-bromfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 102 až 105 °C
4-ethoxy-(4-chlorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 105 až 107 °C
4-ethoxy-(4-fluorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 57 až 60 °C
1-(4-fluorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 104 až 107 °C
1-(3-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	n_D^{20} : 1,5480
1-(4-bromfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 129 až 133 °C

T a b u l k a - pokračování

Název sloučeniny	Fyzikální konstanty
4-ethoxy-4-methyl-1-fenyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	n_D^{20} : 1,5580
4-ethoxy-1-(2-chlorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	n_D^{20} : 1,5610
4-ethoxy-4-methyl-1-(4-nitrofenyl)-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	n_D^{20} : 1,5660
4-ethoxy-(3-chlorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	n_D^{20} : 1,5535
4-ethoxy-1-(4-chlorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 142 až 144 °C
1-(4-fluorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 90,5 až 93,5 °C
4-ethoxy-1-(4-bromfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t. 110 až 112 °C
4-ethoxy-1-(2,4-dichlorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	n_D^{20} : 1,5700
4-ethoxy-1-(3,4-dichlorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 83 až 85 °C
4-ethoxy-4-methyl-1-(4-methylfenyl)-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 84 až 87 °C
4-ethoxy-4-methyl-1-fenyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t. 88 až 92 °C
4-ethoxy-1-(4-fluorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 125 až 127 °C
4-ethoxy-1-(2-chlorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 142 až 145 °C
1-(2-fluorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	n_D^{20} : 1,5380
4-methoxy-1-(4-methoxyfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	n_D^{20} : 1,5870
4-ethoxy-4-methyl-1-(4-nitrofenyl)-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 180 až 182 °C
4-ethoxy-1-(4-bromfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 148 až 152 °C
4-ethoxy-1-(2,4-dichlorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 148 až 152 °C
4-ethoxy-1-(3,4-dichlorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t. 115 až 117 °C
4-ethoxy-4-methyl-1-(4-methylfenyl)-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 120 až 123 °C
4-ethoxy-1-(4-methoxyfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 135 až 137 °C
4-ethoxy-1-(2-furyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	n_D^{20} : 1,5650
4-ethoxy-1-(2-furyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 124 až 127 °C
4-ethoxy-1-(4-methoxyfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 112 až 145 °C
4-ethoxy-4-methyl-1-(2-thienyl)-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 138 až 140 °C

T a b u l k a - pokračování

Název sloučeniny	Fyzikální konstanty
4-ethoxy-4-methyl-1-(2-methylfenyl)- -2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 148 až 152 °C
4-ethoxy-4-methyl-1-(3-pyridyl)-2-(1,2,4- -triazol-1-yl)-1-penten-3-on	
4-ethoxy-4-methyl-1-(3-pyridyl)-2-(1,2,4- -triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	
4-ethoxy-4-methyl-1-(2-naftyl)-2-(1,2,4- -triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 85 až 89 °C
4-ethoxy-4-methyl-1-(2-naftyl)-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 152 až 154 °C
4-methoxy-4-methyl-1-(4-methylfenyl)- -2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 72 až 76 °C
4-methoxy-4-methyl-1-(4-methylfenyl)- -2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 110 až 113 °C
4-methoxy-1-(4-methoxyfenyl)-4-methyl- -2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 90,5 až 95,5 °C
4-methoxy-4-methyl-1-fenyl-2-(1,2,4- -triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 77 až 82 °C
1-(3,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl- -2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 80 až 82 °C
1-(3,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl- -2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 115 až 119 °C
4-methoxy-4-methyl-1-(4-nitrofenyl)-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 124 až 128 °C
4-methoxy-4-methyl-1-(4-nitrofenyl)-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 157 až 160 °C
4-methoxy-4-methyl-1-(2-methylfenyl)- -2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 128 až 133 °C
4-methoxy-4-methyl-1-(2-methylfenyl)- -2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	t. t.: 72 až 76 °C
1-(2-chlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)- -4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-ol	t. t.: 154 až 158 °C
1-(4-chlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)-4- -methoxy-4-methyl-1-penten-3-ol	t. t.: 90 až 95 °C
4-ethoxy-1-(3-chlorfenyl)-4-methyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 114 až 116 °C
1-(3-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 80 až 84 °C
4-n-butoxy-1-(4-chlorfenyl)-4-methyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 85 °C
4-n-butoxy-1-(2-chlorfenyl)-4-methyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 95 °C
4-ethoxy-1-(2-fluorfenyl)-4-methyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	n_D^{20} : 1,5370
4-(n-butoxy)-1-(4-chlorfenyl)-4-methyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	n_D^{20} : 1,5430
4-(n-butoxy)-1-(2-chlorfenyl)-4-methyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	n_D^{20} : 1,5490
4-methoxy-4-methyl-1-(2-pyridyl)-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	t. t.: 104 °C

Sloučeniny podle vynálezu se špatně rozpouštějí ve vodě a lépe či hůře v polárních organických rozpouštědlech, jako jsou alkoholy, například methanol, ethanol atd., dále ethylesteru kyseliny octové, diethyletheru, diisopropyletheru, acetonitrilu a N,N-dimethylformamidu.

Tyto sloučeniny se dobře rozpouštějí v organických rozpouštědlech, jako je například chloroform, methylenchlorid, toluen a xylén.

Sloučeniny podle vynálezu mohou být aplikovány ve formě Z, E-isomerů a ve formě čistých Z- popřípadě E-form. Rozumí se, že k podstatě vynálezu náleží všechny isomery.

Výchozí produkty k výrobě sloučenin podle vynálezu jsou o sobě známe a mohou být připraveny známými postupy.

Následující příklady slouží k objasnění možnosti použití sloučenin podle vynálezu, které jsou k dispozici ve formě uvedených přípravků.

Příklad 3

Sójové rostlinky byly pěstovány ve skleníku do stadia primárního listu. Rostliny byly postříkány sloučeninami podle vynálezu ve formě vodné emulze s dávkami 0,1 až 0,5 kg účinné látky na hektar. Po třech týdnech po aplikaci byla zjištěna celková délka rostlin a potlačení růstu vyjádřeno proti kontrole.

Sloučeniny podle vynálezu	Potlačení růstu v %	
	0,1 kg účinné látky/ha	0,5 kg účinné látky/ha
1-(2,4-dichlorfenyl)-4-methoxy- -4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)- -1-penten-3-on	13	17
1-(2,6-dichlorfenyl)-4-methoxy- -4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)- -1-penten-3-on	11	21
4-methoxy-4-methyl-1-fenyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	3	17
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4- -methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)- -1-penten-3-ol	53	75
Kontrolní činidlo		
2-chlorethyltrimethylamóniumchlorid (Chloromequatchloride)	15	16
kyselina 2-chlorethylfosfoniová (Ethephon)	0	11

Příklad 4

Sójové rostliny byly před vzejitím ošetřeny vodnou emulzí, obsahující 0,5 a 1,0 kg účinné látky zkoušené sloučeniny na hektar a pěstovány ve skleníku.

Po 3 týdnech byla změřena délka rostlin a potlačení růstu vyjádřeno v procentech v porovnání s kontrolními rostlinami. Kromě toho byly z primárních listů vykrojeny kotouče o průměru 1,7 cm. Z těchto kotoučů byl extrahován chlorofyl. Množství chlorofylu bylo stanoveno fotometricky při 665 nm a procentické zvýšení obsahu vyjádřeno v procentech v porovnání s kontrolou.

Z tabulky je patrné, že účinek na potlačení růstu je u sloučenin podle vynálezu jasně průkaznější než u kontrolních sloučenin.

Sloučeniny podle vynálezu	0,5 kg účinné látky/ ha potlače- ní růstu v %	Zvýšení obsahu chlorofylu v %	1,0 kg účinné látky/ha po- tlačení růstu v %	Zvýšení obsahu chlorofylu v %
1-(4-chlorfenyl)-4- -methoxy-4-methyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)- -1-penten-3-on	33	5,8	71	9,7
1-(2,4-dichlorfenyl)- -2-(imidazol-1-yl)-4- -methoxy-4-methyl-1- -penten-3-on	10	15,5	11	17,5
1-(4-chlorfenyl)-4- -methoxy-4-methyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)- -1-penten-3-ol	84	27,4	91	56,5
Kontrolní prostředek (podle DE-OS 30 10 560)				
1-(4-chlorfenyl)-4,4-di- methyl-2-(1,2,4-triazol-1- -yl)-1-penten-3-on	6	1,4	19	0,8
Kontrolní prostředek				
1-(4-chlorfenyl)-4,4-di- methyl-2-(1,2,4-triazol-1- -yl)-1-penten-3-ol	74	12,5	86	36,3

P ř í k l a d 5

Bavlníkové rostliny byly před vzejitím ošetřeny vodnou emulzí testované sloučeniny v množství 1 kg účinné látky/ha. Po 3 týdnech pěstování ve skleníku byly změřeny délky rostlin a vypočteno potlačení růstu v procentech.

Z tabulky je patrný účinek sloučenin podle vynálezu.

Sloučenina podle vynálezu	Procento potlačení růstu
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4- -methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)- -1-penten-3-ol	54
Kontrolní prostředek	
kyselina 2-chlorethyl- fosfoniová (Etephon)	0
1,1-dimethyl-piperidinumchlorid (Mepiquar chlorid)	0

P ř í k l a d 6

Ječmen před vzejitím byl ošetřen vodnou emulzí zkoušené sloučeniny v množství 0,5 a 1 kg účinné látky/ha. Po třech týdnech pěstování ve skleníku byly rostliny změřeny a stanoveno procento potlačení růstu.

Pokusy jasně ukazují, že sloučeniny podle vynálezu vyvolávají značné potlačení růstu obilí, například ječmene. Kontrolní prostředek nevykazoval žádný účinek.

Sloučenina podle vynálezu	Procento potlačení růstu	
	0,5 kg účinné látky na hektar	1,0 kg účinné látky na hektar
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy- -4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)- -1-penten-3-ol	22	35
Kontrolní prostředek		
kyselina 2-chlorethylfosfoniová (Ethephon)	0	0
2-chlorethyltrimethylamonium (Chlormequat chlorid)	0	0

Příklad 7

Keříkové fazole byly preemergentně ošetřeny vodnou emulzí zkoušené sloučeniny v množství 0,5 až 1,0 a 2,0 kg účinné látky/ha. Po třech týdnech byla změřena délka rostlin a potlačení růstu vyjádřeno procentuálně.

Z primárních listů byly kromě toho vykrojeny kotouče o průměru 1,7 cm. Z těchto listových kotoučů byl extrahován chlorofyl a jeho obsah stanoven fotometricky při 665 nm. Následující tabulka uvádí zvýšení obsahu chlorofylu v procentech. Výrazný účinek sloučenin podle vynálezu ve srovnání s kontrolou je z tabulky jasně patrný.

Sloučenina podle vynálezu	Potlačení růstu a zvýšení obsahu chlorofylu u keříkových fazolí					
	Potlačení růstu v %			Zvýšení obsahu chlorofylu v %		
	0,5 (kg úč. látky/ha)	1,0 (kg úč. látky/ha)	2,0 (kg úč. látky/ha)	0,5 (kg úč. látky/ha)	1,0 (kg úč. látky/ha)	2,0 (kg úč. látky/ha)
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	17	60	67	40,7	57,4	85,3
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	92	93	93	154,4	203,9	210,3
Kontrolní prostředek (podle DE-OS 30 10 560)						
1-(4-chlorfenyl)-4,4-dimethyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	75	83	93	121,6	130,9	158,3

Příklad 8

Bavlna, fazole a sója byly preemergentně ošetřeny vodnou emulzí sloučeniny podle vynálezu v množství 0,1, 0,3, 1 a 3 kg účinné látky/ha postřikem, vysazeny ve skleníku a stejnoměrně zalévány. Po 3 týdnech pěstování byla závlhka zastavena a rostliny po jedno nebo vícedenním nezalévání podrobeny bonitaci podle následujícího schématu:

- | | |
|--------------------------------------|-------------------------|
| 0 = rostliny plně turgescentní | 2 = vadnutí listu |
| 1 = příznaky vadnutí | 3 = silné vadnutí listu |
| 4 = uschlé listy, papírového vzhledu | |

Bonitace 1, 2 a 5 dnů po ukončení závlhky.

Sloučenina podle vynálezu	Použité množství úč. látky/ha	Bavlna			Fazole			Sója		
		1	2	5 dnů	1	2	5 dnů	1	2	5 dnů
1-(4-chlorfenyl)-4-	0,1	-	-	-	-	-	-	3/4	4	4
-methoxy-4-methyl-2-	0,3	-	-	-	-	-	-	2	4	4
-(1,2,4-triazol-1-yl)-	1,0	-	-	-	-	-	-	1	2	4
-1-penten-3-on	3,0	-	-	-	-	-	-	0	1	4
1-(4-chlorfenyl)-4-	0,1	0	2	3	0	0	4	0	1	4
-methoxy-4-methyl-2-	0,3	0	1	3	0	0	3	0	0	3
-(1,2,4-triazol-1-yl)-	1,0	0	0	2	0	0	2	0	0	2
-1-penten-3-ol	1,0	0	0	2	0	0	2	0	0	2
Kontrola		1	3	4	2	4	4	3/4	4	4

:- pokus neprováděn

Tabulka ukazuje, že sloučeniny podle vynálezu vyvolávají u rostlin vyšší odolnost vůči suchu. Zatímco bylo u všech kontrolních rostlin pozorováno již po dvou dnech silné vadnutí, vydržely ošetřené rostliny zčásti více než dva dny bez zalévání.

P ř í k l a d 9

Hrách a rajčata byla preemergentně ošetřena postřikem vodné emulze sloučeniny podle vynálezu v dávce 1 a 2 kg účinné látky/ha. Po 3 týdnech pěstování ve skleníku byla zjištěna délka rostlin a procentuálně vyjádřeno potlačení růstu. Získané výsledky jsou uvedeny v tabulce.

Sloučenina podle vynálezu	Použité množství účinné látky/ha	Hrách	Rajče
1-(4-chlorfenyl)-4-			
-methoxy-4-methyl-2-	1	53	12
-(1,2,4-triazol-1-yl)-	2	66	25
-1-penten-3-on			
1-(4-chlorfenyl)-4-			
-methoxy-4-methyl-2-	1	73	62
-(1,2,4-triazol-1-yl)-	2	73	75
-1-penten-3-ol			
Porovnávací činidlo			
1-(4-chlorfenyl)-4,4-			
-dimethyl-2-(1,2,4-	1	53	62
-triazol-1-yl)-1-penten	2	73	62
-3-ol			

Ukazuje se, že sloučeniny podle vynálezu vykazují při dávce 1 kg účinné látky/ha stejný účinek jako srovnávací činidlo při dávce 2 kg účinné látky/ha.

P ř í k l a d 10

Sója byla preemergentně ošetřena postřikem vodné emulze sloučeniny podle vynálezu v dávce 0,5 kg účinné látky/ha, vyseta ve skleníku a rovnoměrně zalévána. Po 3 týdnech pěstování bylo zalévání ukončeno. O 4 dny později byly rostliny podrobeny bonitaci podle schéma, uvedeného v příkladu 8.

Sloučeniny podle vynálezu	Bonitace
4-methoxy-4-methyl-1-(2-thienyl)-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	2
1-(4-bromfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	2
1-(3-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	1
1-(4-bromfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	0
4-methoxy-1-(4-chlorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	0
1-(4-fluorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	0
kontrola	4

Příklad 11

Ve skleníku byly preemergentně ošetřeny sloučeninou podle vynálezu uvedené rostliny v následujících množstvích.

Za tímto účelem byly sloučeniny použity ve formě suspensí s 500 litry vody/ha a aplikovány rovnoměrně do půdy. 3 týdny po ošetření byla provedena bonitace podle stupnice

- 0 až 10, kde značí
 0 = zničení rostlin
 1 až 4 = dokonalá až velmi silná inhibice rostlin
 5 až 7 = silná až střední inhibice rostlin
 8 až 9 = nepatrná inhibice rostlin
 10 = normální růst rostlin.

Z tabulky vyplývá, že sloučeniny podle vynálezu vyvolávají dokonalou inhibici vývoje široké řady plevelů, které jsou tak zbaveny konkurenční schopnosti. Tento účinek je možno využít v boji proti plevelům.

Sloučeniny podle vynálezu 1-(4-chlorfenyl)-4- -methoxy-4-methyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)- -1-penten-3-ol	0,3 kg/ha	1,0 kg/ha	3,0 kg/ha
Stellaria m.	3	0	0
Abutilon h.	4	3	2
Matricaria ch.	0	0	0
Viola t.	0	0	0
Centaurea c.	4	2	1
Amaranthus r.	6	4	2
Galium a.			
Chrysanthemum s.	5	1	1
Ipomea p.	7	5	4
Polygonum f.	3	2	1
Avena f.	6	5	4
Alopekurus m.	8	6	5
Echinochloa c. g.	9	8	4

T a b u l k a - pokračování

Sloučeniny podle vynálezu			
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	0,3 kg/ha	1,0 kg/ha	3,0 kg/ha
Setaria i.	7	6	4
Digitaria s.	7	5	3
Cyperus es.	8	4	3
Sorghum h.	10	5	4
Poa a.	5	3	1
Kontrola		10	

P ř í k l a d 12

Účinek profylaktického ošetření listů proti Erysiphe cichoracearum u dýně ve skleníku

Mladé rostliny dýně byly ošetřeny postřikem o uvedených koncentracích účinné látky a po zaschnutí postřiku inokulovány rozešlepenými suchými spórami Erysiphe cichoracearum. Současně byly inokulovány neošetřené rostliny jako kontrola. Rostliny byly inkubovány ve skleníku při 24 °C. Po jednom týdnu byly vyhodnoceny napadené plochy listu a vyjádřeny v % celkové plochy listu. Fungicidní účinek se vypočte podle následující rovnice:

$$100 - \frac{100 \cdot \text{napadení u ošetřených}}{\text{napadení u neošetřených}} = \% \text{ účinnosti}$$

Sloučeniny se použijí jako 20% formulace.

T a b u l k a:

% účinnosti proti Erysiphe cichoracearum

Sloučeniny podle vynálezu	Koncentrace účinné látky	
	0,025 %	0,005 %
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100	100
1-(2-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100	100
1-(2,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100	60
1-(2,6-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100	95
4-methoxy-4-methyl-1-fenyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100	95

T a b u l k a - pokračování

Sloučeniny podle vynálezu	Koncentrace účinné látky	
	0,025 %	0,005 %
1-(4-chlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	100	100
4-methoxy-4-methyl-1-(2-thienyl)-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100	94
2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-(2-thienyl)-1-penten-3-on	100	90
1-(2,4-dichlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	100	100
1-(2,6-dichlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	100	100
1-(2-chlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	100	100
2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-fenyl-1-penten-3-on	100	98
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	100	100
1-(2,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	100	100
1-(3,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100	
Naftalendisulfonát	100	
1-(2-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	100	
4-methoxy-4-methyl-1-(2-thienyl)-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	100	
1-(4-bromfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100	

P ř í k l a d 13

Účinek ošetření listu proti *Piricularia oryzae* na rostlinkách rýže ve skleníku

Mladé rostlinky rýže byly postřikány postřikem o koncentraci účinné látky 0,1 %. Po uschnutí postřiku byly ošetřené i neošetřené rostliny naočkovány suspenzí spor (asi 200 000/ml) původce skvrnitosti listů *Piricularia oryzae* a inkubovány ve vlhku při +25 až +27 °C ve skleníku.

Po 5 dnech bylo vyhodnoceno, kolik procent plochy listu bylo napadeno. Z této hodnoty se vypočte fungicidní účinnost podle následující rovnice:

$$100 - \frac{100 \cdot \text{napadení u ošetřených}}{\text{napadení u neošetřených}} = \% \text{ účinnosti}$$

Sloučeniny se použily ve formě 20% formulace.

T a b u l k a :

% účinnosti proti *Piricularia oryzae*

Sloučeniny podle vynálezu	Koncentrace účinné látky 0,1 %
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	82
1-(2-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	90
1-(4-chlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	82
2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-(2-thienyl)-1-penten-3-on	80
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	80

P ř í k l a d 14

Účinek profylaktického ošetření listů vinné révy proti *Plasmopara viticola* ve skleníku

Mladé rostlinky vinné révy ve stádiu asi 5 až 8 listů byly postříkány roztokem o koncentraci účinné látky 0,025 % a po vyschnutí postřiku naočkovány vodným nálevem sporangíí hub na spodní straně listu (asi 20 000 sporangíí na ml) a rychle inkubovány ve skleníku při 22 až 24 °C a pokud možno v atmosféře vodní páry. Po druhém dnu byla vlhkost vzduchu na 3 až 4 dny upravena na normální hodnotu (30 až 70 % nasycení) a potom na jeden den nahrazena atmosférou nasycenou vodní parou. Následně bylo z každého listu vyhodnoceno procento napadení a průměr z každého ošetření vyjádřen jako fungicidní účinnost podle následující rovnice:

$$100 - \frac{100 \cdot \text{napadení u ošetřených}}{\text{napadení u neošetřených}} = \% \text{ účinnosti}$$

Sloučeniny se používají jako 20% formulace.

T a b u l k a :

% účinnosti proti *Plasmopara viticola*

Sloučeniny podle vynálezu	Koncentrace účinné látky 0,025 %
1-(2-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	98
1-(2,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	80

T a b u l k a - pokračování

Sloučeniny podle vynálezu	Koncentrace účinné látky 0,025 %
1-(2,4-dichlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	80
1-(2,6-dichlorfenyl)-2-imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	80

P ř í k l a d 15

Účinek profylaktického ošetření listů u rajčatových rostlin proti *Botrytis cinerea* ve skleníku

Mladé rostliny rajčete byly ošetřeny postřikem 0,025 % účinné látky. Po uschnutí postřiku byly ošetřené i neošetřené rostliny naočkovány suspenzí spor (asi 1 milión na ml roztoku šťávy) šedé mazlavé hniloby *Botrytis cinerea*. Následně byly rostliny inkubovány ve skleníku při asi 20 °C a vysoké vlhkosti vzduchu. Po polehnutí neošetřených rostlin (= 100 % napadení) bylo zjištěno procento napadení u ošetřených rostlin a z následující rovnice vypočtena fungicidní účinnost:

$$100 - \frac{100 \cdot \text{napadení u ošetřených}}{\text{napadení u neošetřených}} = \% \text{ účinnosti}$$

Použitá sloučenina podle vynálezu 1-(2,4-dichlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on ve 20 % formulaci omezila napadení o 80 %.

P ř í k l a d 16

Ošetření osiva proti *Helminthosporium gramineum*

Osivo ječmene s přirozeným napadením *Helminthosporium gramineum* bylo neošetřené, respektive ošetřené (viz tabulka) a bylo vyseto do květináčů s půdou a ponecháno vyklížit při teplotě pod +16 °C. Vzešlé rostlinky byly osvětlovány 12 hodin denně. Po asi 5 týdnech byly spočteny napadené rostliny a shromážděny společně vzešlé rostliny z každého pokusného řádku. Fungicidní účinnost se vypočte podle rovnice:

$$100 - \frac{100 \cdot \text{napadení u ošetřených}}{\text{napadení u neošetřených}} = \% \text{ účinnosti}$$

Sloučeniny se použily ve formě 20% formulace.

T a b u l k a

Účinnost proti *Helminthosporium gramineum*

Sloučeniny podle vynálezu	50 g účinné látky/100 kg
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy- -4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1- -yl)-1-penten-3-on	75
1-(2-chlorfenyl)-4-methoxy- -4-methyl-2-(1,2,4-triazol- -1-yl)-1-penten-3-on	70
1-(2,4-dichlorfenyl)-4-methoxy- -4-methyl-2-(1,2,4-triazol- -1-yl)-1-penten-3-on	60
4-methoxy-4-methyl-1-fenyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten- -3-on	90
1-(4-chlorfenyl)-2-(imidazol- -1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1- -penten-3-on	60
2-imidazol-1-yl)-4-methoxy-4- -methyl-1-(2-thienyl)-1-penten- -3-on	65
1-(2-chlorfenyl)-2-(imidazol-1- -yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten- -3-on	65
2-imidazol-1-yl)-4-methoxy-4- -methyl-1-fenyl-1-penten-3-on	60

P ř í k l a d 17

Systemický účinek ošetření osiva proti obilné hluchotě *Erysiphe graminis* na ječmeni

Osivo jarního ječmene MGZ ošetřené a neošetřené bylo vyseto v květináčích ve skleníku při 20 °C a ponecháno vyklíčit. Po vytvoření prvního děložního lístku byly rostliny naočkovány přetřením napadenými rostlinami. Po týdnu bylo stanoveno, kolik procent plochy listu bylo pokryto plísní.

Fungicidní účinnost se vypočte z rovnice

$$100 - \frac{100 \cdot \text{napadení u ošetřených}}{\text{napadení u neošetřených}} = \% \text{ účinnosti}$$

Sloučeniny podle vynálezu se použijí ve formě 20% formulace.

T a b u l k a:

% účinnosti proti *Erysiphe graminis*

Sloučeniny podle vynálezu	50 g účinné látky/100 kg
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100
1-(2,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100
1-(4-chlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	90
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	100

P ř í k l a d 18

Účinek ošetření osiva pšenice proti *Tilletia caries*

Osivo pšenice bylo kontaminováno 3 g spor *Tilletia caries* na kg osiva. Neošetřené, respektive ošetřené obilky byly vsazeny svými ochmyřenými konci do Petriho misek s vlhkou hlínou a inkubovány 3 dny při teplotách pod +12 °C. Následně byly obilky vyjmuty a Petriho misky se zbylými spory dále inkubovány při teplotě pod +12 °C. Po 10 dnech byly spory vyšetřeny na klíčivost. Fungicidní účinnost byla stanovena ze vztahu:

$$100 - \frac{100 \cdot \text{klíčení-\% u ošetřených}}{\text{klíčení-\% u neošetřených}} = \% \text{ účinnosti}$$

Sloučenin byly ve formě 20% formulace.

T a b u l k a

% účinnost ošetření osiva proti *Tilletia caries*

Sloučeniny podle vynálezu	50 g účinné látky/100 kg
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100
1-(2-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100
1-(2,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100
4-methoxy-4-methyl-1-fenyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	90

Příklad 19

Ošetření žita proti *Fusarium nivale* (*Gerlachia nivalis*) u osiva

Osiivo žita s přirozeným napadením *Fusarium nivale*, ošetřené a neošetřené (kontrola) bylo vyseto do květináčů. Květináče byly umístěny při 6 °C. Po vzejití rostlin bylo zapojeno osvětlení a zajištěna téměř 100% vlhkost vzduchu. Tři týdny po výsevu bylo zjištěno procento napadení. Z průměrné hodnoty pěti opakování byla vypočtena hodnota fungicidní účinnosti.

$$100 - \frac{100 \cdot \text{napadení u ošetřených}}{\text{napadení u neošetřených}} = \% \text{ účinnosti}$$

Tabulka

% účinnosti proti *Fusarium nivale*

Sloučeniny podle vynálezu	50 g účinné látky/100 kg
4-methoxy-4-methyl-1-fenyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten- -3-on	82
1-(2,4-dichlorfenyl)-2-(imidazol- -(1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten- -3-on	100
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4- -methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)- -1-penten-3-ol	80

Příklad 20

Účinek profylaktického ošetření listů rostlin ječmene proti *Helminthosporium teres*

Mladé rostliny ječmene byly postříkány roztokem o koncentraci 0,05 % účinné látky. Po uschnutí kapek postřiku byly ošetřené i neošetřené rostliny přetřeny suspenzí konidií (asi 50 000 ml) *Helminthosporium teres* a inkubovány ve vlhku ve skleníku při 20 až 22 °C. Po jednom týdnu bylo stanoveno procento napadení. Ze získaného počtu byla vypočtena fungicidní účinnost podle rovnice:

$$100 - \frac{100 \cdot \text{napadení u ošetřených}}{\text{napadení u neošetřených}} = \% \text{ účinnosti}$$

Sloučeniny byly použity ve formě 20% formulace.

T a b u l k a

% účinnost profylaktického ošetření postřikem

Sloučeniny podle vynálezu	Helminthosporium teres 0,5 % účinné látky
2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-(2-thienyl)-1-penten-3-on	95
1-(2,6-dichlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	90
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	95
1-(3,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-1-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on Naftalendisulfonát	89
1-(2-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	94
1-(4-fluorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	86
1-(3-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	95
1-(4-bromfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	95
4-ethoxy-4-methyl-1-fenyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	95
4-ethoxy-1-(4-chlorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	97

P ř í k l a d 21

Účinek profylaktického ošetření listů ječmene ve skleníku proti Erysiphe graminis

Mladé rostliny ječmene byly postřikány roztokem o koncentraci účinné látky 0,05 %. Po vyschnutí postřiku byly ošetřené a neošetřené rostliny (kontrola) naočkovány potřením rostlin rostlinami, napadenými Erysiphe graminis, takže konidie této houby mohly přijít v suchém stavu ve styk s pokusnými rostlinami. Následně byly pokusné rostliny inkubovány ve skleníku při 20 až 22 °C. Po jednom týdnu bylo zjištěno procento napadení listů. Z těchto hodnot byla vypočtena fungicidní účinnost z následujícího vztahu:

$$100 - \frac{100 \cdot \text{napadení u ošetřených}}{\text{napadení u neošetřených}} = \% \text{ účinnosti}$$

Sloučeniny byly použity ve 20% formulaci.

T a b u l k a

% účinnosti profylaktického postřiku

Sloučeniny podle vynálezu	<i>Erysiphe graminis</i> 0,05 % účinné látky
1-(3,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on Naftalendisulfonát	100
1-(2-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	100
4-methoxy-4-methyl-1-(2-thienyl)-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	90
4-ethoxy-(4-fluorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	90
1-(4-fluorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	99
1-(3-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100
1-(4-bromfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	100
4-ethoxy-4-methyl-1-fenyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	98
4-ethoxy-4-methyl-1-(4-nitrofenyl)-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	95
4-ethoxy-(3-chlorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	90
4-ethoxy-1-(4-chlorfenyl)-4-methyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	99

P ř í k l a d 22

Účinek profylaktického ošetření listů ječmene ve skleníku proti *Puccinia hordei* (rez).

Mladé rostliny ječmene byly postřikány roztokem o koncentraci účinné látky 0,05 %. Po vyschnutí kapek postřiku byly ošetřené i neošetřené rostliny za sucha inokulovány přetřením napadenými rostlinami. Následně byly pokusné rostliny inkubovány ve skleníku při teplotě 15 až 17 °C a vyšší vzdušné vlhkosti.

Po půlrohu týdnu bylo stanoveno procento podílu napadené listové plochy. Fungicidní účinnost byla vypočtena podle rovnice:

$$100 - \frac{100 \cdot \text{napadení u ošetřených}}{\text{napadení u neošetřených}} = \% \text{ účinnosti}$$

Sloučeniny byly použity ve formě 20% formulace.

T a b u l k a

% účinnosti profylaktického postřiku

Sloučeniny podle vynálezu	Puccinia hordei 0,05 % účinné látky
1-(4-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl- -2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100
1-(2-chlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl- -2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	96
1-(2,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl- -2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	90
1-(2,6-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl- -2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100
4-methoxy-4-methyl-1-fenyl-2-(1,2,4- -triazol-1-yl)-1-penten-3-on	100
1-(4-chlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)-4- -methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	100
4-methoxy-4-methyl-1-(2-thienyl)-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	95
1-(2,4-dichlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)- -4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	100
1-(2,6-dichlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)- -4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	100
1-(2-chlorfenyl)-2-(imidazol-1-yl)- -4-methoxy-4-methyl-1-penten-3-on	90
2-(imidazol-1-yl)-4-methoxy-4-methyl- -1-fenyl-1-penten-3-on	100
1-(3,4-dichlorfenyl)-4-methoxy-4-methyl- -(2-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on Naftalendisulfonát	85
4-methoxy-4-methyl-1-(2-thienyl)-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	90
1-(4-fluorfenyl)-4-methoxy-4-methyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-on	80
4-ethoxy-1-(4-chlorfenyl)-4-methyl-2- -(1,2,4-triazol-1-yl)-1-penten-3-ol	85

P Ř E D M Ě T V Y N Á L E Z U

1. Prostředek s fungicidním a herbicidním účinkem a účinkem regulujícím růst rostlin vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje azolylpentenový derivát obecného vzorce I

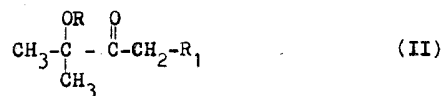


kde

- R znamená alkyl s 1 až 4 atomy uhlíku,
 R₁ znamená 1-imidazolyl nebo 1,2,4-triazol-1-yl,
 R₂ znamená fenyl, methylfenyl, methoxyfenyl, halogenfenyl, dichlorfenyl, nitrofenyl, naftyl, pyridyl, furyl nebo thienyl a

Z znamená skupinu vzorce $\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-$ nebo $\overset{\text{OH}}{\parallel}\text{CH}-$.

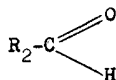
2. Způsob výroby účinné látky podle bodu 1, vyznačující se tím, že se nechá reagovat sloučenina obecného vzorce II



kde

R a R₁ mají výše uvedený význam,

se sloučeninou obecného vzorce III



kde

R₂ má výše uvedený význam,

které jsou popřípadě rozpuštěné v rozpouštědle, za přítomnosti katalyzátoru a získaný reakční produkt se Z ve významu $-\text{CO}-$ se případně redukuje na sloučeninu se Z ve významu $-\text{CH}(\text{OH})-$.