

(19) **DANMARK**



PATENTDIREKTORATET
TAASTRUP

(12) **FREMLÆGGELSESSKRIFT**



(11) **159551 B**

21) Patentansøgning nr.: 3554/77

(51) Int.Cl.⁵

C 07 D 249/64

22) Indleveringsdag: 09 aug 1977

A 01 N 43/653

41) Alm. tilgængelig: 11 feb 1978

44) Fremlagt: 29 okt 1990

86) International ansøgning nr.: -

30) Prioritet: 10 aug 1976 US 713308 27 apr 1977 US 791632

71) Ansøger: *JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.: Turnhoutsebaan 30; B-2340 Beerse, BE

72) Opfinder: Jan *Heeres; BE, Leo J. J. *Backx; BE, Joseph A. *Mostmans, BE

74) Fuldmægtig: Th. Ostfeld Patentbureau A/S

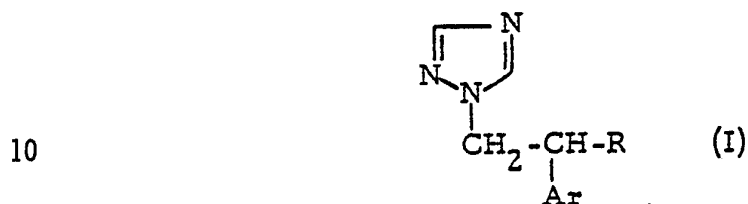
54) **1H-1,2,4-triazolderivater med antifungal og plantevækstregulerende virkning samt præparat til bekæmpelse af fungi**

(56) Fremdragne publikationer

DK ans. nr. 2935/75 (DK freml. skrift nr. 138601)
4821/76 (DK freml. skrift nr. 145196) PLS2. 2. 3

Den foreliggende opfindelse angår hidtil ukendte 1H-1,2,4-triazol-derivater med antifungal og plantevækstregulerende virkning samt et præparat til bekæmpelse af fungi, der som aktiv komponent omfatter en effektiv antifungal mængde af et sådant derivat.

5 De omhandlede hidtil ukendte 1H-1,2,4-triazolderivater har den almene formel:



hvor i Ar betegner phenyl, mono-, di- eller trihalogenphenyl, lavere alkylphenyl, lavere alkoxyphenyl, nitrophenyl, cyanophenyl eller trifluor-
15 methylphenyl, og

R betegner alkyl med fra 1 til 10 carbonatomer, cycloalkyl, cycloalkyl-lavere alkyl, lavere alkenyl, aryl-lavere alkyl eller aryloxy-lavere alkyl, idet aryl betegner phenyl, naphthalenyl eller substitueret phenyl, hvor den substituerede phenylgruppe er phenyl med fra 1 til 3
20 substituenten, uafhængigt udvalgt blandt halogen, lavere alkyl, lavere alkyloxy, cyano, nitro og phenyl, med den forudsætning, at kun én af substituenterne kan være cyano, nitro eller phenyl, når der er mere end én substituent til stede.

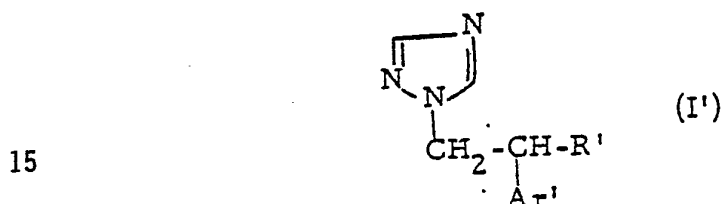
Også de fysiologisk acceptable syreadditionssalte af forbindelserne
25 med den almene formel (I) er omfattet af den foreliggende opfindelse.

Fra dansk patentansøgning nr. 2935/75 (DK fremlæggeskrift nr. 138.601) kendes beslægtede forbindelser med fungicid virkning. Forbindelserne ifølge opfindelsen udmærker sig i forhold til de således kendte forbindelser ved en kraftigere fungicid virkning, således som det frem-
30 går af de senere anførte sammenligningsforsøg.

Med den i definitionen af R anvendte betegnelse "alkyl" er det hensigten at indbefatte ligekædede og forgrenede alifatiske carbonhydridradikaler indeholdende fra 1 til 10 carbonatomer, såsom f.eks. methyl, ethyl, 1-methylethyl, 1,1-dimethylethyl, propyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, butyl, pentyl, hexyl, heptyl, octyl, decyl og lignende; be-
35 tegnelsen "lavere alkyl" refererer som anvendt heri til ligekædede eller forgrenede alkylradikaler med fra 1 til ca. 6 carbonatomer, såsom f.eks. methyl, ethyl, 1-methylethyl, propyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl,

butyl, pentyl, hexyl og lignende; betegnelsen "lavere alkenyl" refererer til ligekædede eller forgrenede umættede alkenylradikaler med fra 3 til 6 carbonatomer, såsom f.eks. 2-propenyl, 1-methyl-2-propenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 2-hexenyl og lignende; betegnelsen "cycloalkyl" refererer til
 5 cykliske carbonhydridradikaler med fra 3 til 6 carbonatomer, såsom cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl og cyclohexyl; og betegnelsen "halogen" er generisk for halogener med en atomvægt på mindre end 127, d.v.s. chlor, brom, fluor og iod.

En foretrukket gruppe af forbindelser med den almene formel (I) kan
 10 illustreres ved den almene formel (I'):



hvor

Ar' betegner phenyl, mono- eller di-halogenphenyl eller methylphenyl, og

20 R' betegner alkyl med fra 1 til 10 carbonatomer, cycloalkyl, lavere alkenyl, arylmethyl og arylethyl, hvori arylgruppen fortrinsvis er phenyl, halogenphenyl, methylphenyl eller methoxyphenyl.

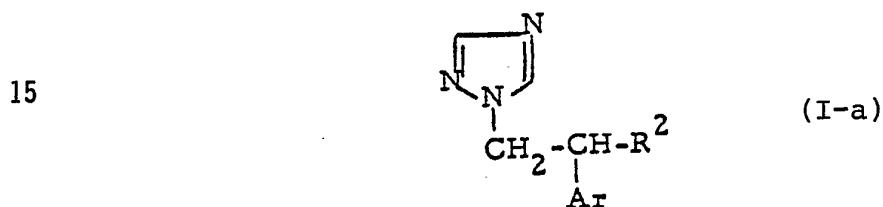
Særligt foretrukne forbindelser med den almene formel (I') er forbindelserne, hvori Ar' betegner phenyl, chlorphenyl, fluorphenyl, bromphenyl, dichlorphenyl, dibromphenyl eller methylphenyl, hvorefter de mest
 25 foretrukne er dichlor- og dibromphenyl; og hvori R' betegner alkyl med fra 1 til 8 carbonatomer, cycloalkyl eller 2-propenyl, idet de mest foretrukne er alkyl med fra 1 til 6 carbonatomer og 2-propenyl.

Typiske eksempler på foretrukne forbindelser med den almene formel
 30 (I') er følgende:

- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)propyl]-1H-1,2,4-triazol;
- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazol;
- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)pentyl]-1H-1,2,4-triazol;
- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-3-methylbutyl]-1H-1,2,4-triazol;
- 35 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-4-pentenyl]-1H-1,2,4-triazol;
- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)hexyl]-1H-1,2,4-triazol;
- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-4-methylpentyl]-1H-1,2,4-triazol;
- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-3-methylpentyl]-1H-1,2,4-triazol;

- 1-[2-(2,4-dichlorophenyl)heptyl]-1H-1,2,4-triazol;
 1-[2-cyclopentyl-2-(2,4-dichlorophenyl)ethyl]-1H-1,2,4-triazol;
 1-[2-cyclohexyl-2-(2,4-dichlorophenyl)ethyl]-1H-1,2,4-triazol;
 1-[3-(4-chlorophenyl)-2-(2,4-dichlorophenyl)propyl]-1H-1,2,4-triazol;
 5 1-[2-(2,4-dibromophenyl)hexyl]-1H-1,2,4-triazol;
 1-[2-(2,4-dibromophenyl)-4-methylpentyl]-1H-1,2,4-triazol;
 1-[2-(2,4-dibromophenyl)-3-methylbutyl]-1H-1,2,4-triazol;
 1-[2-(2,4-dibromophenyl)-3-methylpentyl]-1H-1,2,4-triazol;
 1-[2-(4-fluorophenyl)-4-(4-methylphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazol, og
 10 1-[4-(4-chlorophenyl)-2-(4-fluorophenyl)-butyl]-1H-1,2,4-triazol.

Den gruppe af forbindelser med den almene formel (I), som kan il-
 lustreres ved den almene formel (I-a)



hvor Ar har den tidligere definerede betydning, og R² betegner alkyl,
 20 cycloalkyl, cycloalkyl-lavere alkyl, lavere alkenyl, aryl-lavere alkyl
 eller aryloxy-lavere alkyl, kan bekvemt fremstilles ved N-alkylering af
 1H-1,2,4-triazol (II) med en passende reaktiv ester med formelen (III)
 hvori Ar og R² har de tidligere definerede betydninger og X betegner en
 reaktiv esterfunktion, såsom f.eks. halogen, methylsulfonyloxy, (4-me-
 25 thylphenyl)sulfonyloxy og lignende.

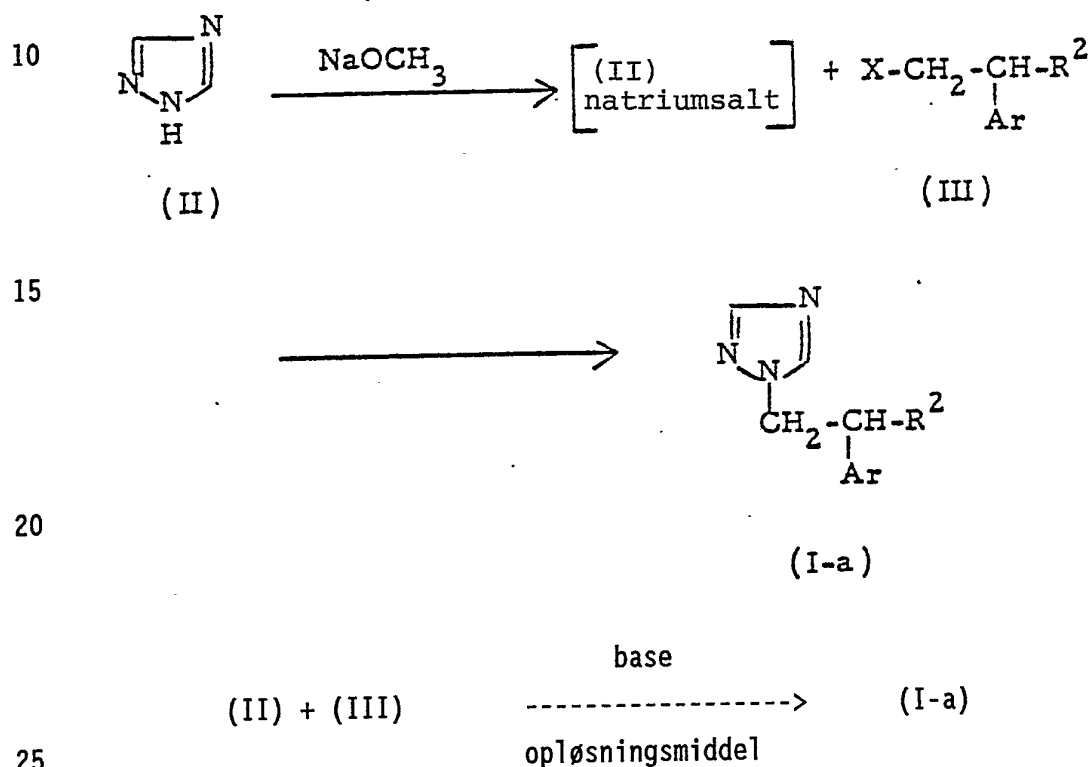
Ved gennemførelse af omsætningen af (II) og (III) er det hensigts-
 mæssigt først at omdanne (II) til et alkalimetalsalt, fortrinsvis natri-
 umsaltet, ved omsætning af (II) med en passende stærk metalbase, såsom
 f.eks. natriumhydrid, natriummethanolat, natriumamid og lignende og der-
 30 efter omrøre og opvarme metalsaltet med (III) i et passende polært orga-
 nisk opløsningsmiddel. Passende opløsningsmidler til dette formål indbe-
 fatter amider, såsom f.eks. N,N-dimethylformamid og N,N-dimethylacet-
 amid, og nitriler, såsom f.eks. acetonitril, benzonitril og lignende.

(II) og (III) kan alternativt omsættes direkte med hinanden uden
 35 forudgående saltdannelse, i hvilket tilfælde omsætningen fortrinsvis ud-
 føres i et passende polært organisk opløsningsmiddel som ovenfor define-
 ret, i nærværelse af en passende base til opsamling af den under omsæt-
 ningen frigjorte syre. Passende baser, som med fordel kan anvendes ind-

befatter uorganiske baser, såsom f.eks. natrium- og kaliumcarbonat og -hydrogencarbonat og lignende, og organiske baser, såsom f.eks. N,N-diethylethanamin, pyridin og lignende. Det er hensigtsmæssigt at anvende noget forhøjet temperatur til forøgelse af omsætningshastigheden, og om-

5 sætningen udføres særligt foretrukket ved reaktionsblandingsens reflux-temperatur.

De foregående omsætninger kan illustreres på følgende måde:



Det er klart, at forbindelserne med den almene formel (I), der fås ved at følge de før beskrevne fremgangsmåder, isoleres fra reaktionsblandingen og om nødvendigt renses yderligere under anvendelse af meto-

30 dikker, som er kendte indenfor området.

Forbindelserne med den almene formel (I), som er opnået på baseform ved de foregående fremgangsmåder, kan omdannes til deres fysiologisk acceptable syreadditionssalte ved omsætning med en passende syre, som f.eks. en uorganisk syre, såsom hydrohalogensyre, d.v.s. saltsyre, brom-

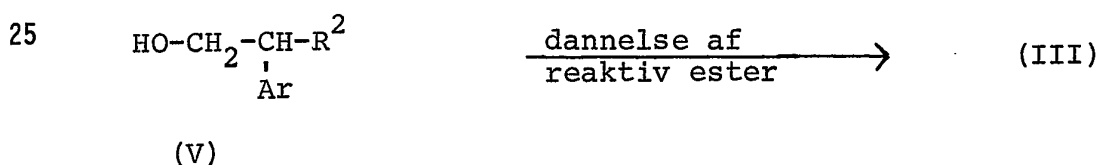
35 syre eller jodsyre; svovlsyre, salpetersyre eller thiocyanasyre; en phosphorsyre; en organisk syre, såsom eddikesyre, propansyre, hydroxyeddikesyre, 2-hydroxypropansyre, 2-oxopropansyre, ethandicarboxylsyre, propan-

dicarboxylsyre, butandicarboxylsyre (Z)-2-butendicarboxylsyre, (E)-2-bu-

tendicarboxylsyre, 2-hydroxybutandicarboxylsyre, 2,3-dihydroxybutandicarboxylsyre, 2-hydroxy-1,2,3-propantricarboxylsyre, benzoesyre, 3-phenyl-2-propensyre, α -hydroxybenzeneddikesyre, methansulfonsyre, ethansulfonsyre, hydroxyethansulfonsyre, 4-methylbenzensulfonsyre, 2-hydroxybenzoesyre, 4-amino-2-hydroxybenzoesyre, 2-phenoxybenzoesyre eller 2-acetyloxybenzoesyre. Tilsvarende kan saltene omdannes til de tilsvarende frie baser på sædvanlig måde, f.eks. ved omsætning med alkali, såsom natrium- eller kaliumhydroxid.

Nogle af de reaktive estermellemprodukter med den almene formel (III) er kendte forbindelser, og de kan alle fremstilles ved de indenfor området kendte fremgangsmåder, som beskrevet i litteraturen til fremstillingen af disse kendte forbindelser. Sådanne forbindelser og fremgangsmåder til fremstilling deraf er f.eks. beskrevet i U.S.A. patentskrift nr. 3.927.017.

I al almindelighed fremstilles mellemprodukterne med den almene formel (III) ved omdannelse af den tilsvarende alkohol (V) til den ønskede reaktive ester i overensstemmelse med de metodikker, som er almindeligt kendt indenfor området. F.eks. fås methansulfonater og 4-methylbenzensulfonater let ved behandling af alkoholen med henholdsvis methansulfonylchlorid og 4-methylbenzensulfonylchlorid i nærværelse af en passende syreacceptor, såsom f.eks. pyridin. Halogenider kan fås ved behandling af alkoholen med et passende halogeneringsmiddel, såsom f.eks. phosphorpentachlorid, phosphortribromid, etc.



Mellemproduktalkoholerne med den almene formel (V), hvoraf nogle er kendte, kan fremstilles ved kendte fremgangsmåder, såsom f.eks. følgende:

Et passende substitueret arylacetonitril med den almene formel (VI) alkyleres med en passende reaktiv ester R^2X (VII). Denne alkyleringsreaktion gennemføres fortrinsvis ved, at arylacetonitrilet først bringes i kontakt med en passende stærk base, såsom f.eks. natriumhydrid, hvorefter den reaktive ester sættes til reaktionsblandingen. Passende opløsningsmidler for denne omsætning indbefatter amider, såsom N,N-dimethyl-

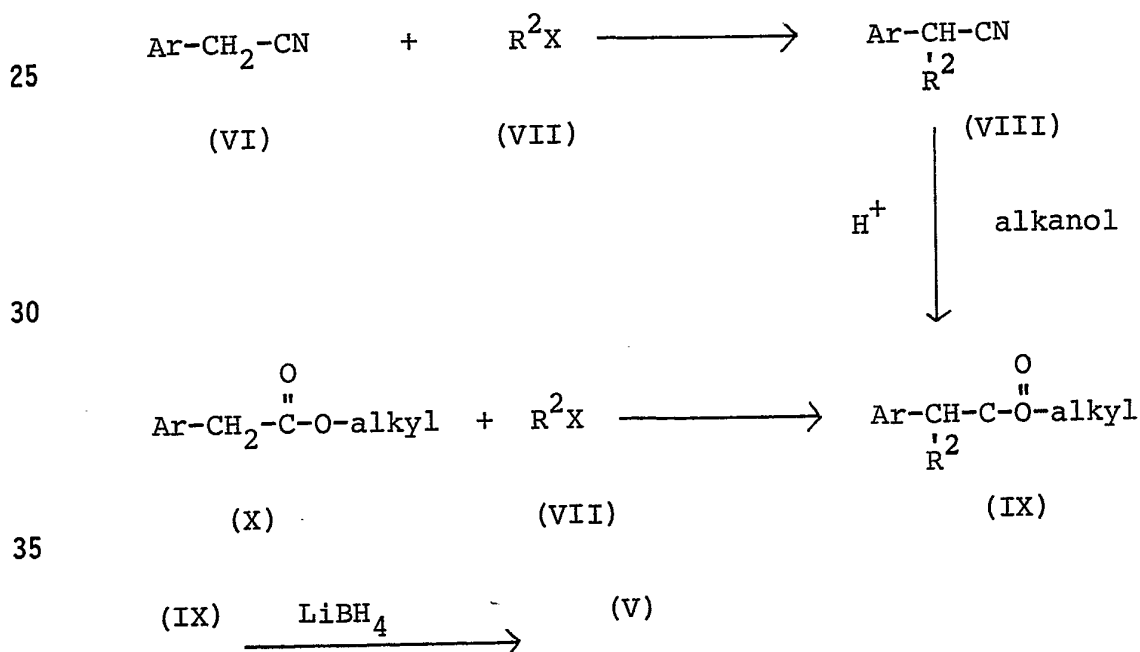
formamid, N,N-dimethylacetamid og hexamethylphosphortriamid, andre sædvanlige polære opløsningsmidler, såsom dimethylsulfoxid, eller blandinger af sådanne opløsningsmidler med f.eks. et aromatisk carbonhydrid, såsom benzen.

5 Det substituerede arylacetonnitril (VIII), som fås ved foregående trin, omdannes dernæst til en alkylester (IX) af den tilsvarende carboxylsyre. Denne nitril-til-ester omdannelse kan gennemføres i et trin, f.eks. ved opvarmning af nitrilet i en passende alkohol eller en blanding af alkohol med et passende reaktionsinert organisk opløsningsmiddel, 10 såsom 2,2'-oxybispropan i nærværelse af en stærk, ikke-oxiderende mineralsyre, såsom f.eks. saltsyre. Alternativt kan nitrilet først hydrolyseres til den tilsvarende aryleddikesyre på sædvanlig måde, f.eks. med natriumhydroxid i 1,2-ethandiol, og denne syre kan derefter omdannes til den ønskede ester på traditionel måde.

15 Estrene (IX) kan også fås ved alkylering af et passende alkylaryl-
acetat (X) med R^2X i overensstemmelse med kendte fremgangsmåder.

Alkoholerne (V) fås dernæst efter reduktion af (IX) med et passende reduktionsmiddel, såsom f.eks. lithiumaluminiumhydrid, lithiumborhydrid eller natriumborhydrid i nærværelse af et lithiumsalt, fortrinsvis et halogenid, såsom lithiumiodid eller lithiumchlorid.

De førnævnte reaktioner kan illustreres skematisk på følgende måde:



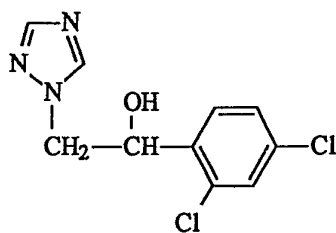
Udgangsmaterialerne med de almene formler (VI) og (VII) er almindeligt kendte, og de kan fremstilles ved hjælp af fremgangsmåder, som er kendte indenfor området. F.eks. kan udgangsmaterialerne med den almene formel (VII), hvori R^2 står for aryloxy-lavere alkyl, og X står for halogen, let fremstilles ved O-alkylering af en passende hydroxyarenforbindelse med en passende dihalogen-lavere alkan under anvendelse af f.eks. vandig alkali som omsætningsmedium.

På grund af tilstedeværelsen af et asymmetrisk carbonatom i de omhandlede forbindelser (I) er det klart, at de kan eksistere i form af stereokemiske optiske isomere (enantiomere). Om ønsket kan opløsningen og isoleringen eller fremstillingen af en særlig form gennemføres under anvendelse af de sædvanlige principper, som er kendte inden for området. Disse enantiomere er naturligvis omfattet af den omhandlede opfindelse.

Forbindelserne med den almene formel (I) og syreadditionssaltene deraf er nyttige midler til bekæmpelse af fungi. De er særligt nyttige som potente jordbrugsfungicider, idet de er aktive overfor et bredt spektrum af fungi, såsom f.eks. de fungi, som er ansvarlige for forekomsten af skimmel på forskellige plantearter, f.eks. *Erysiphe graminis*, *Erysiphe polygoni*, *Erysiphe cichoracearum*, *Erysiphe polyphaga*, *Podosphaera leucotrichia*, *Sphaerotheca pannosa*, *Sphaerotheca mors-uvae* og *Uncinulla necator* og overfor andre fytopatogene fungi, såsom f.eks. *Septoria apii* og *Uromyces phaseoli*.

De nyttige antifungale egenskaber af forbindelserne ifølge opfindelsen illustreres mere tydeligt ved resultaterne opnået ved de efterfølgende forsøg.

Til sammenligning er anført resultater opnået med forbindelsen ifølge eksempel 5 i DK fremlæggeskrift nr. 138.601 under samme betingelser. Denne forbindelse har formlen

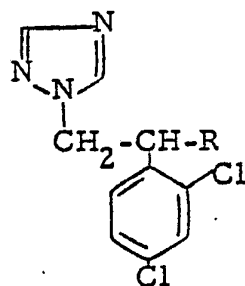


A. Profylaktisk virkning over for Erysiphe cichoracearum på agurker ved bladvækstbehandling.

- Unge agurkeplanter, ca. 10 dage gamle, sprøjtedes med en vandig opløsning indeholdende 100, 10 eller 1 ppm af forbindelsen, som skulle undersøges, mens kontrolplanter ikke blev behandlet. Efter tørring af planterne gennemførtes kunstig infektion med sporer af Erysiphe cichoracearum ved, at planterne blev gnedet let med et stærkt inficeret blad. Den 15. dag efter den kunstige infektion vurderedes graden af fungusangreb ved bestemmelse af den procentuelle del af bladoverfladen, som var angrebet af fungus. Der anvendtes 3 planter pr. objekt, og middelværdier beregnedes for disse 3 planter. Resultaterne vises i tabel I og II ved hjælp af følgende pointsystem:

15	<u>Point</u>	<u>% angrebet bladoverflade</u>
	0	0
	1	≤ 10
	2	11 til 50
20	3	> 50

Tabel I: Profylaktisk virkning overfor Erysiphe cichoracearum på agurker (bladvækstbehandling).

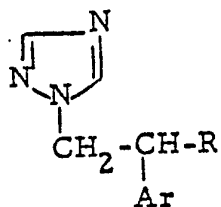


Forbin- delse nr.	R	Base eller salt	Point		
			100 ppm	10 ppm	1 ppm
1	CH ₃	base	0	0	0
2	C ₂ H ₅	base	0	0	0
3	nC ₃ H ₇	base	0	0	0
4	iC ₃ H ₇	HNO ₃	0	0	0
5	nC ₄ H ₉	HNO ₃	0	0	0
6	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	HNO ₃	0	0	0
7	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	HNO ₃	0	0	0
8	nC ₈ H ₁₇	HNO ₃	0	0	2
9	CH ₂ -CH=CH ₂	HNO ₃	0	0	0
10		HNO ₃	0	0	1
11		base	0	1	2
12	(CH ₂) ₂ - 	base	0	1	2
13	CH ₂ - 	HNO ₃ 0.5 H ₂ O	1	3	3
14	(CH ₂) ₂ - 	base	0	0	2
15	CH ₂ -(4-Cl-C ₆ H ₄)	HNO ₃	0	0	3
16	CH ₂ -(2-Br-C ₆ H ₄)	HNO ₃	0	0	0
17	CH ₂ -(4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄)	HCl	0	0	2
18	(CH ₂) ₂ -O-(4-Br-C ₆ H ₄)	HNO ₃	0	0	3
19	(CH ₂) ₃ -O-(3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	HNO ₃	1	2	3

Tabel I: (fortsat)

Forbin- delse nr.	R	Base eller salt	Point		
			100 ppm.	10 ppm.	1 ppm.
20	$(\text{CH}_2)_3\text{-O-(3-CH}_3\text{-4-Cl-C}_6\text{H}_3)$	HNO_3	1	3	3
21	$(\text{CH}_2)_3\text{-O-(2-CH}_3\text{-4-Cl-C}_6\text{H}_3)$	HNO_3	1	0	2
22	$(\text{CH}_2)_3\text{-O-(2-Br-4-CH}_3\text{-C}_6\text{H}_3)$	HNO_3	0	0	1
23	$(\text{CH}_2)_3\text{-O-(2,4-Cl}_2\text{-6-CH}_3\text{-C}_6\text{H}_2)$	HNO_3	2	2	3
24	$(\text{CH}_2)_3\text{-O-(2,4,6-Br}_3\text{-C}_6\text{H}_2)$	HNO_3	0	0	1
25	$(\text{CH}_2)_3\text{-O-(2-Cl-4-C}_6\text{H}_5\text{-C}_6\text{H}_3)$	HNO_3	0	1	2
26	$(\text{CH}_2)_3\text{-O-(2-naphthalenyl)}$	HNO_3	0	0	2

Tabel II: Profylaktisk virkning overfor Erysiphe cichoracearum på agurker (bladvækstbehandling).



Forbin- delse nr.	Ar	R	Base eller salt	Point		
				100 ppm	10 ppm	1 ppm
36	2,4-Br ₂ -C ₆ H ₃	nC ₄ H ₉	HNO ₃	0	0	0
37	2-Cl-C ₆ H ₄	(CH ₂) ₂ -(4-Br-C ₆ H ₄)	HCl	0	1	2
38	4-Cl-C ₆ H ₄	(CH ₂) ₂ -(4-Cl-C ₆ H ₄)	HCl	0	1	2
39	4-Br-C ₆ H ₄	(CH ₂) ₂ -(4-Cl-C ₆ H ₄)	base	0	2	3
40	4-Br-C ₆ H ₄	(CH ₂) ₂ -(2-OCH ₃ - C ₆ H ₄)	HCl	0	1	2
41	4-Br-C ₆ H ₄	(CH ₂) ₂ -(4-Br-C ₆ H ₄)	HCl	0	3	3
42	4-F-C ₆ H ₄	(CH ₂) ₂ -(4-Cl-C ₆ H ₄)	HCl	-	0	1
43	4-F-C ₆ H ₄	(CH ₂) ₂ -(4-CH ₃ - C ₆ H ₄)	HCl	0	0	1
44	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	(CH ₂) ₂ -(4-Cl-C ₆ H ₄)	HCl	0	2	3
Forb. ifølge eks. 5 i DK 138.601				0	1	3

B. Profylaktisk virkning over for Erysiphe graminis på byg ved blad-
vækstbehandling.

Unge bygplanter, ca. 8 cm høje, sprøjtedes med en vandig opløsning indeholdende 100, 10 eller 1 ppm af forbindelsen, som skulle undersøges, mens kontrolplanter ikke behandledes. Efter tørring af planterne inficeredes de kunstigt ved pudring med conidier af Erysiphe graminis. Fungusangreb vurderedes 10 dage derefter på samme måde som beskrevet i forsøg A. Resultaterne af dette forsøg vises i tabel III, hvor numrene på forbindelserne og pointsystemet er som i tabel I og II.

Tabel III: Profylaktisk virkning overfor Erysiphe graminis på byg
ved bladvækstbehandling

Forbindelse nr.	Point		
	100 ppm.	10 ppm.	1 ppm.
1	1	1	3
2	0	0	2
3	0	1	2
4	0	1	2
5	0	1	2
6	0	0	1
7	0	1	1
8	0	1	2
9	0	1	3
10	0	1	2
11	1	2	2
12	1	3	3

Tabel III: (fortsat)

Forbindelse nr.	Point		
	100 ppm.	10 ppm.	1 ppm
13	0	0	1
14	1	3	3
15	0	1	1
16	1	2	3
17	1	2	3
18	1	2	3
19	1	3	3
22	1	2	3
24	1	3	3
26	2	2	3
36	0	0	1
37	1	3	3
38	0	0	1
39	2	3	3
40	1	3	3
41	1	2	3
42	1	1	1
43	0	1	1
44	0	0	1
Forb. ifølge eks. 5 i DK 138.601	0	3	3

C. Systemisk aktivitet overfor Erysiphe cichoracearum på agurker.

Unge agurkeplanter, ca. 10 dage gamle, behandlede ved vandig af jorden med en vandig opløsning af forsøgsforbindelsen. Der blev tilført
 5 100 ml pr. plante, og den samlede mængde forsøgsforbindelse var 10 eller 1 mg pr. plante. Kontrolprøver blev behandlet med samme mængde af opløsningen men uden aktiv komponent. 4 dage derefter inficeredes planterne kunstigt med Erysiphe cichoracearum ved, at planterne blev gnedet let med et stærkt inficeret blad. Vurdering af fungusangreb blev foretaget
 10 15 dage derefter på samme måde som beskrevet under forsøg A. Resultaterne er anført i tabel IV, hvor numrene på forbindelserne og pointsystemet er som i tabel I og II.

Tabel IV: Systemisk aktivitet overfor Erysiphe cichoracearum på agurker.

15

Forbindelse nr.	Point	
	10 mg /plant	1 mg /plant
1	0	0
2	0	0
3	0	1
4	0	1
5	2	3
6	0	3
7	0	3
9	1	2
10	2	2
11	2	2
12	2	3
15	2	3
18	2	2
36	2	2
Forb. ifølge eks. 5 i DK 138.601	0	2

D. Profylaktisk aktivitet overfor Uromyces phaseoli på bønner ved bladvækstbehandling.

5 Unge bønneplanter, ca. 15 cm høje, sprøjtedes med en vandig opløsning indeholdende 250, 100 eller 10 ppm af forsøgsforbindelsen, mens kontrolprøver ikke behandlede. Efter tørring inficeredes planterne kunstigt ved, at de sprøjtedes med en suspension af sporer af Uromyces phaseoli. Derefter inkuberedes planterne i 24 timer ved 18°C og en relativ fugtighed på 95-100%. Fungusangreb vurderedes 10 dage efter den kunstige infektion på samme måde som under forsøg A. Resultaterne er anført i tabel V, hvor der er anvendt samme numre på forbindelserne og samme point-system som i tabel I og II.

Tabel V: Profylaktisk aktivitet overfor Uromyces phaseoli på bønner ved bladvækstbehandling

Forbindelse nr.	Point		
	250 ppm.	100 ppm.	10 ppm.
1	1	2	3
2	1	1	3
3	1	1	2
4	0	1	1
5	0	0	3
6	0	0	1
7	0	0	2
9	0	0	3
10	0	2	3
11	2	3	3
Forb. ifølge eks. 5 i DK 138.601	3	3	3

Udover den antifungale virkning har forbindelserne med den almene formel (I) værdifulde plantevækstregulerende egenskaber. Afhængende af forskellige faktorer, såsom arten af planterne, som undersøges, og den administrerede dosis af aktiv komponent, kan den observerede virkning
5 være vækststimulering eller vækstinhibering. Som sådanne er forbindelserne ifølge opfindelsen nyttige som plantevækstregulatorer, og denne nyttige egenskab er naturligvis også omfattet af den foreliggende opfindelses omfang.

I kraft af de førnævnte antifungale og vækstregulerende virkninger
10 tilvejebringer den foreliggende opfindelse værdifulde præparater indeholdende de omhandlede triazoler med den almene formel (I) eller syreadditionssaltene deraf som den aktive komponent i et opløsningsmiddel eller et fast, semi-fast eller flydende fortyndingsmiddel eller bæremedium, og den tilvejebringer yderligere en effektiv fremgangsmåde til be-
15 kæmpelse af fungusvækst under anvendelse af en effektiv antifungal mængde af sådanne triazoler (I) eller salte deraf. De omhandlede forbindelser kan anvendes i passende opløsningsmidler eller fortyndingsmidler, i form af emulsioner, suspensioner, dispersioner eller salver, på passende faste eller semi-faste bærematerialer, i sædvanlige eller syntetiske sæ-
20 ber, detergenter eller dispersionsmedier, om ønsket sammen med andre forbindelser med arachnicid, insekticid, ovicid, fungicid og/eller baktericid virkning eller sammen med inaktive additiver.

Faste bærematerialer, som er egnede til fremstillingen af præparater i pulverform indbefatter forskellige inerte, porøse og pulverformige
25 fordelingsmidler af uorganisk eller organisk natur, såsom f.eks. tricalciumphosphat, calciumcarbonat i form af præpareret kridt eller formalet kalksten, kaolin, bolus, bentonit, talkum, kiselgur og borsyre; pulveriseret kork, savsmuld og andre fine pulverformige materialer af vegetabilsk oprindelse er også egnede bærematerialer.

30 Den aktive komponent blandes med disse bærematerialer, f.eks. ved at blive formalet dermed. Alternativt imprægneres det inerte bæremateriale med en opløsning af den aktive komponent i et let flygtigt opløsningsmiddel, og opløsningsmidlet fjernes derefter ved opvarmning eller ved filtrering med sugning ved reduceret tryk. Ved tilsætning af befugtnings- og/eller dispergeringsmidler kan sådanne pulverformige præparater
35 også gøres let befugtelige med vand, således at der opnås suspensioner.

Inerte opløsningsmidler, som anvendes til fremstillingen af flydende præparater bør fortrinsvis ikke være let antændelige og bør såvidt

muligt være lugtfri og såvidt muligt ikke-toxiske overfor varmblodede dyr og mennesker eller planter i de pågældende omgivelser. Opløsningsmidler, som er egnede til dette formål, er højt kogende olier, f.eks. af vegetabilsk oprindelse og laverekogende opløsningsmidler med flammepunkt på mindst 30°C, såsom f.eks. polyethylenglycol, isopropanol, dimethylsulfoxid, hydrogenerede naphthalener og alkylerede naphthalener. Det er naturligvis også muligt at anvende blandinger af opløsningsmidler. Opløsninger kan fremstilles på sædvanlig måde, om nødvendigt ved hjælp af opløsningsfremmende midler. Andre flydende former, som kan anvendes, er emulsioner eller suspensioner af den aktive forbindelse i vand eller passende inerte opløsningsmidler eller koncentrater til fremstilling af sådanne emulsioner, hvilke direkte kan indstilles til den krævede koncentration. Til dette formål blandes den aktive komponent f.eks. med et dispergeringsmiddel eller en emulgator. Den aktive komponent kan også opløses eller dispergeres i et passende inert opløsningsmiddel og blandes samtidig eller senere med et dispergeringsmiddel eller en emulgator.

Det er også muligt at anvende semi-faste bærematerialer af creme-, salve-, pasta- eller voks lignende natur, hvori den aktive komponent kan inkorporeres, om nødvendigt ved hjælp af opløsningsfremmende midler og/eller emulgatorer. Vaseline og andre creme baser er eksempler på semi-faste bærematerialer.

Desuden er det muligt, at den aktive komponent kan anvendes i form af aerosoler. Til dette formål opløses eller dispergeres den aktive komponent, om nødvendigt ved hjælp af passende inerte opløsningsmidler som bærevæsker, såsom difluordichlormethan, som ved atmosfærisk tryk koger ved en temperatur, der er lavere end stuetemperatur, eller i andre flygtige opløsningsmidler. På denne måde opnås opløsninger under tryk, som, når de udsprøjtes, giver aerosoler, som er særligt egnede til kontrolring eller bekæmpelse af fungi, f.eks. i lukkede rum og lagerrum, og til anvendelse på vegetation til udryddelse eller til forebyggelse af fungusinfektioner.

De omhandlede forbindelser og præparaterne deraf kan tilføres ved hjælp af konventionelle metoder. F.eks. kan en fungusvækst eller et materiale, som skal behandles eller beskyttes mod angreb af fungus, behandles med de pågældende forbindelser og præparaterne deraf ved pudring, stenkning, sprøjtning, pensling, dypning, påsmøring, imprægnering eller andre passende midler.

Når de omhandlede forbindelser anvendes i kombination med passende

bærere, f.eks. i opløsning, suspension, pudder, pulver, salve, emulsion og lignende former iagttages en høj aktivitet i et meget stort fortyndingsområde. F.eks. har koncentrationer af den aktive ingrediens i intervallet fra 0,1 - 10 vægtprocent baseret på vægten af det anvendte præparat vist sig at være effektiv til bekæmpelse af fungi. Naturligvis kan
5 også højere koncentrationer anvendes, når den særlige situation berettiger det.

Det er hensigten med de efterfølgende eksempler at illustrere, men ikke begrænse omfanget af den foreliggende opfindelse. Med mindre andet
10 er angivet, er alle dele på vægtbasis.

Eksempel 1

Til en omrørt og tilbagesvalet blanding af 122 dele 4-chlor-3-methylphenol, 214,1 dele 1,3-dibrompropan og 850 dele vand sættes dråbevis, i løbet af en periode på 1 time, en opløsning af 34 dele natriumhydroxid i 213 dele vand. Efter endt tilsætning fortsættes omrøringen
15 under tilbagesvaling natten over. Reaktionsblandingen afkøles til stuetemperatur, og produktet ekstraheres med 765 dele benzen. Ekstrakten vaskes med en 10% natriumhydroxidopløsning, tørres, filtreres og inddampes. Remanensen destilleres to gange til opnåelse af 114 dele 4-(3-brompropoxy)-1-chlor-2-methylbenzen, kogepunkt 119°C ved 0,6 mm tryk.
20

Eksempel 2

Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 1 og anvende en ækvivalent
25 mængde af en passende substitueret phenol i stedet for 4-chlor-3-methylphenol, anvendt deri, fremstilles følgende mellemprodukter:

- 1-(3-brompropoxy)-4-chlor-2-methylbenzen, kogepunkt 115-116°C ved 0,6 mm tryk;
- 2-(3-brompropoxy)-1,5-dichlor-3-methylbenzen, kogepunkt 118°C ved
30 0,6 mm tryk,
- 4-(3-brompropoxy)-3-chlor-[1,1'-biphenyl],
- 2-brom-1-(3-brompropoxy)-4-methylbenzen, kogepunkt 123-126°C ved 0,8 mm tryk, og
- 1,3,5-tribrom-2-(3-brompropoxy)benzen, kogepunkt 160-177°C.

35

Eksempel 3

Til en omrørt og afkølet (vandbad) opslæmning af 7 dele 78% natriumhydriddispersion i 75 dele dimethylsulfoxid sættes dråbevis, i løbet

af en 30 minutters periode en opløsning af 37 dele 2,4-dichlorbenzenacet
tonitril i 100 dele dimethylsulfoxid. Det hele omrøres i 30 minutter,
mens der afkøles i vandbad. Dernæst tilsættes dråbevis, i løbet af en 30
minutters periode, en opløsning af 56 dele 1-brom-4-(2-bromethoxy)benzen
5 i 125 dele dimethylsulfoxid, og omrøringen fortsættes i yderligere 30
minutter. Reaktionsblandingen hældes på vand, og produktet ekstraheres
to gange med 2,2'-oxybispropan. De forenede ekstrakter vaskes to gange
med vand, tørres, filtreres og inddampes. Remanensen tritureres i petro-
leumsether. Produktet frafiltreres og krystalliseres fra ethanol til op-
10 nåelse af 38 dele α -[2-(4-bromphenoxy)ethyl]-2,4-dichlorbenzenacetonitril, smeltepunkt 73,9°C.

Eksempel 4

En blanding af 18,5 dele 2,4-dichlorbenzenacetoneitril og 180 dele
15 N,N-dimethylformamid omrøres og afkøles i isbad under indførelse af ni-
trogengas. 3,2 dele af en 78% natriumhydroxidopløsning tilsættes dråbe-
vis, og det hele omrøres i 1 time. Der tilsættes dernæst dråbevis, i lø-
bet af en periode på 1 time, 17,8 dele (brommethyl)cyclohexan under sta-
dig afkøling og under stadig indførelse af nitrogengas. Efter endt til-
20 sætning fortsættes omrøringen i 2 timer ved stuetemperatur. Reaktions-
blandingen hældes på vand. Det bundfældede produkt frafiltreres og tri-
tureres i en blanding af methanol og vand. Produktet frafiltreres og
tørres til opnåelse af 25,5 dele 2,4-dichlor- α -(cyclohexylmethyl)benzen-
acetoneitril, smeltepunkt 58,8°C.

25

Eksempel 5

Ved gentagelse af fremgangsmåden i eksempel 4 og ved anvendelse af
ækvimolære mængder af de passende udgangsmaterialer fremstilles:

α -(3-butenyl)-2,4-dichlorbenzenacetoneitril, kogepunkt 104-108°C ved
30 0,1 mm tryk, og
2,4-dichlor- α -(2-cyclopentylethyl)benzenacetoneitril, kogepunkt 130-
135°C ved 0,05 mm tryk.

Eksempel 6

35 Til en omrørt og afkølet (isbad) blanding af 27,5 dele 2,4-dibrom-
benzenacetoneitril, 135 dele N,N-dimethylformamid og 67,5 dele benzen
sættes portionsvis 3,2 dele af en 78% natriumhydriddispersion under ind-
førelse af nitrogengas. Efter omrøring i 1 time tilsættes dråbevis 14

dele 1-brombutan. Efter endt tilsætning fortsættes omrøringen i 2 timer ved stuetemperatur. Reaktionsblandingen hældes på vand, og produktet ekstraheres to gange med 2,2'-oxybispropan. De forenede ekstrakter vaskes to gange med vand, tørres, filtreres og inddampes. Remanensen destillerer til opnåelse af 22 dele 2,4-dibrom- α -butylbenzenacetonitril, kogepunkt 124°C ved 0,05 mm tryk.

Eksempel 7

Ved gentagelse af fremgangsmåden i eksempel 6 og anvendelse af en ækvivalent mængde af henholdsvis et passende bromid og et passende arylacetonitril i stedet for 1-brombutan og 2,4-dibrombenzenacetonitril, anvendt deri, fremstilles følgende forbindelser:

- 2,4-dichlor- α -[3-(4-chlor-3-methylphenoxy)propyl]benzenacetonitril, kogepunkt 216-219°C ved 0,05 mm tryk;
- 2,4-dichlor- α -[3-(3,5-dichlorphenoxy)propyl]-benzenacetonitril, kogepunkt 210-215°C ved 0,05 mm tryk;
- 2,4-dichlor- α -[3-(2-naphthalenyloxy)propyl]benzenacetonitril, smeltepunkt 100°C;
- α -[3-(2-bromphenoxy)propyl]-2,4-dichlorbenzenacetonitril; smeltepunkt 61,2°C;
- 2,4-dichlor- α -[3-(4-chlor-2-methylphenoxy)propyl]benzenacetonitril; smeltepunkt 73°C;
- 2,4-dichlor- α -[3-(2,4-dichlor-6-methylphenoxy)propyl]benzenacetonitril, kogepunkt 212-216°C ved 0,05 mm tryk;
- 2,4-dichlor- α -[3-(3-chlor-[1,1'-biphenyl]-4-yloxy)propyl]benzenacetonitril, smeltepunkt 70,3°C;
- α -[3-(2-brom-4-methylphenoxy)propyl]-2,4-dichlorbenzenacetonitril, kogepunkt 215-219°C ved 0,05 mm tryk, og
- 2,4-dichlor- α -[3-(2,4,6-tribromphenoxy)propyl]benzenacetonitril, smeltepunkt 85,2°C.

Eksempel 8

Til en omrørt blanding af 18,5 dele 2,4-dichlorbenzenacetonitril, 90 dele N,N-dimethylformamid og 67,5 dele benzen sættes dråbevis 3,2 dele af en 78% natriumhydriddispersion under indførelse af nitrogengas. Efter omrøring i 1 time ved stuetemperatur tilsættes 14,5 dele (2-chlor-ethyl)cyclohexan. Det hele omrøres først i 5 timer ved 40-50°C og dernæst natten over ved stuetemperatur. Reaktionsblandingen hældes på vand,

og produktet ekstraheres to gange med 2,2'-oxybispropan. De forenede ekstrakter vaskes to gange med vand, tørres, filtreres og inddampes. Remanensen destilleres til opnåelse af 16 dele (54%) 2,2'-dichlor- α -(2-cyclohexylethyl)benzenacetanitril, kogepunkt 145-148°C ved 0,05 mm tryk.

5

Eksempel 9

Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 8 og anvende ækvivalente mængder af de passende udgangsmaterialer fremstilles:

- α -(2,4-dichlorphenyl)-[1,1'-biphenyl]-4-propannitril, kogepunkt
10 215-230°C ved 0,05 mm tryk;
2,4-dichlor- α -(2,4-dichlorphenyl)benzenbutannitril som en olieagtig remanens;
4-chlor- α -(4-chlorphenyl)benzenbutannitril som en olieagtig remanens;
15 4-chlor- α -(4-methylphenyl)benzenbutannitril, kogepunkt 175-178°C ved 0,1 mm tryk;
 α -(4-bromphenyl)-2-methoxybenzenbutannitril som en olieagtig remanens;
 α -(4-bromphenyl)-4-chlorbenzenbutannitril som en olieagtig remanens;
20 nens;
4-chlor- α -(4-fluorphenyl)benzenbutannitril, kogepunkt 165-168°C ved 0,1 mm tryk;
 α -(4-fluorphenyl)-4-methylbenzenbutannitril, kogepunkt 160-165°C ved 0,3 mm tryk;
25 4-brom- α -(2-chlorphenyl)benzenbutannitril, kogepunkt 176-180°C ved 0,1 mm tryk, og
4-brom- α -(4-bromphenyl)benzenbutannitril som en olieagtig remanens.

Eksempel 10

- 30 120 dele methanol mættes med gasformig hydrogenchlorid under afkøling i isbad. Der tilsættes dernæst 22 dele 2,4-dibrom- α -butylbenzenacetanitril, og det hele omrøres og tilbagesvales natten over. Reaktionsblandingen afkøles og hældes på vand. Produktet ekstraheres med 2,2'-oxybispropan. Ekstrakten vaskes med vand, tørres, filtreres og inddampes.
35 Remanensen destilleres til opnåelse af 16,5 dele (68%) methyl-2,4-dibrom- α -butylbenzenacetat, kogepunkt 125°C ved 0,1 mm tryk.

Eksempel 11

Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 10 fremstilles de følgende estere, idet man går ud fra de passende nitriler:

- 5 methyl- α -(3-butenyl)-2,4-dichlorbenzenacetat som en remanens;
methyl-2,4-dichlor- α -(cyclohexylmethyl)benzenacetat som en remanens;
methyl-2,4-dichlor- α -(2-cyclopentylethyl)benzenacetat som en remanens;
methyl-2,4-dichlor- α -(2-cyclohexylethyl)benzenacetat som en remanens;
10 methyl- α -(2,4-dichlorphenyl)-[1,1'-biphenyl]-4-propanoat som en olieagtig remanens;
methyl-2,4-dichlor- α -(2,4-dichlorphenyl)benzenbutanoat som en olieagtig remanens;
15 methyl-4-chlor- α -(4-chlorphenyl)benzenbutanoat, kogepunkt 175-178°C ved 0,1 mm tryk;
methyl-2,4-dichlor- α -(3-(2-naphthalenyloxy)propyl)benzenacetat, smeltepunkt 69,7°C;
methyl-4-chlor- α -(4-methylphenyl)benzenbutanoat som en olieagtig
20 remanens;
methyl- α -(4-bromphenyl)-2-methoxybenzenbutanoat, kogepunkt 178-185°C ved 0,1 mm tryk;
methyl- α -(4-bromphenyl)-4-chlorbenzenbutanoat, kogepunkt 177-180°C ved 0,1 mm tryk;
25 methyl-4-chlor- α -(4-fluorphenyl)benzenbutanoat som en olieagtig remanens;
methyl- α -(4-fluorphenyl)-4-methylbenzenbutanoat som en remanens;
methyl-4-brom- α -(2-chlorphenyl)benzenbutanoat som en olieagtig remanens;
30 methyl-4-brom- α -(4-bromphenyl)benzenbutanoat som en olieagtig remanens;
methyl- α -[2-(4-bromphenoxy)ethyl]-2,4-dichlorbenzenacetat som en remanens;
methyl-2,4-dichlor- α -[3-(3,5-dichlorphenoxy)propyl]benzenacetat som
35 en remanens;
methyl-2,4-dichlor- α -[3-(4-chlor-3-methylphenoxy)propyl]benzenacetat som en remanens;
methyl- α -[3-(2-bromphenoxy)propyl]-2,4-dichlorbenzenacetat som en

remanens;

methyl-2,4-dichlor- α -[3-(4-chlor-2-methylphenoxy)propyl]benzenacetat som en olieagtig remanens;

5 methyl-2,4-dichlor- α -[3-(2,4-dichlor-6-methylphenoxy)propyl]benzenacetat som en remanens;

methyl- α -[3-(2-brom-4-methylphenoxy)propyl]-2,4-dichlorbenzenacetat som en remanens;

methyl-2,4-dichlor- α -[3-(3-chlor-[1,1'-biphenyl]-4-yloxy)propyl]benzenacetat, og

10 methyl-2,4-dichlor- α -[3-(2,4,6-tribromphenoxy)propyl]benzenacetat som en olieagtig remanens.

Eksempel 12

Til en omrørt blanding af 22 dele methyl-2,4-dichlorbenzenacetat og
15 135 dele N,N-dimethylformamid sættes 3,1 del af en 78% natriumhydriddispersion under indførelse af nitrogengas. Det hele omrøres, til skumning er ophørt, og afkøles i isbad. Der tilsættes dernæst 16 dele iodmethan. Efter endt tilsætning fortsættes omrøringen i 3 timer ved stuetemperatur. Reaktionsblandingen hældes på vand, og produktet ekstraheres med
20 2,2'-oxybispropan. Ekstrakten vaskes med vand, tørres, filtreres og indampes til opnåelse af 20 dele (80%) methyl-2,4-dichlor- α -methylbenzenacetat som en remanens.

Eksempel 13

25 Til en omrørt blanding af 22 dele methyl-2,4-dichlorbenzenacetat og 135 dele N,N-dimethylformamid sættes 3,1 del af en 78% natriumhydriddispersion under indførelse af nitrogengas. Efter omrøring, indtil skumning er ophørt, tilsættes 15 dele 2-brompropan, og det hele omrøres i 3 timer ved stuetemperatur. Reaktionsblandingen hældes på vand, og produktet
30 ekstraheres to gange med 2,2'-oxybispropan. De forenede ekstrakter vaskes med vand, tørres, filtreres og indampes til opnåelse af 24,5 dele (94%) methyl-2,4-dichlor- α -(1-methylethyl)benzenacetat som en remanens.

Til 140 dele 1,1'-oxybisethan sættes 3 dele lithiumaluminiumhydrid. Der tilsættes dernæst dråbevis en opløsning af 24,5 dele methyl-2,4-dichlor- α -(1-methylethyl)benzenacetat i 35 dele 1,1'-oxybisethan under af-
35 køling i vandbad. Efter endt tilsætning fortsættes omrøringen natten over ved stuetemperatur. Der tilsættes successivt 3 dele af en 50% natriumhydroxidopløsning og 1 del vand, og det hele omrøres i 1 time ved

stuetemperatur. Blandingen filtreres over et filtreringshjælpemiddel af typen "hyflo", og filterkagen vaskes med 2,2'-oxybispropan. Filtratet indampes til opnåelse af 20,5 dele (93,5%) 2,4-dichlor- β -(1-methylethyl)benzenethanol som en remanens.

5

Eksempel 14

En blanding af 16,5 dele methyl-2,4-dibrom- α -butylbenzenacetat, 11,5 dele lithiumiodidhydrat og 180 dele acetonitril omrøres til alt faststof er opløst. Dernæst tilsættes portionsvis 3,6 dele natriumborhydrid. Efter endt tilsætning opvarmes det hele til tilbagesvaling, og omrøringen fortsættes natten over ved tilbagesvalingstemperatur. Efter afkøling gøres reaktionsblandingen sur med fortyndet saltsyreopløsning og hældes på vand. Produktet ekstraheres med 2,2'-oxybispropan. Ekstrakten vaskes med vand, tørres, filtreres og indampes til opnåelse af 15 dele (100%) 2,4-dibrom- β -butylbenzenethanol som en remanens.

15

Eksempel 15

Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 14 og anvende en ækvivalent mængde af en passende methylester som udgangsmateriale opnås de følgende alkoholer som en remanens:

20

- β -(3-butenyl)-2,4-dichlorbenzenethanol;
- 2,4-dichlor- β -methylbenzenethanol;
- 2,4-dichlor- β -(cyclohexylmethyl)benzenethanol;
- 2,4-dichlor- β -(2-cyclopentylethyl)benzenethanol;
- 25 2,4-dichlor- β -(2-cyclohexylethyl)benzenethanol;
- β -(2,4-dichlorphenyl)-[1,1'-biphenyl]-4-propanol;
- 2,4-dichlor- β -(2,4-dichlorphenyl)benzenbutanol;
- 4-chlor- β -(4-chlorphenyl)benzenbutanol;
- 4-(chlor- β -(4-methylphenyl)benzenbutanol;
- 30 β -(4-bromphenyl)-2-methoxybenzenbutanol;
- β -(4-bromphenyl)-4-chlorbenzenbutanol;
- 4-chlor- β -(4-fluorphenyl)benzenbutanol;
- β -(4-fluorphenyl)-4-methylbenzenbutanol;
- 4-brom- β -(2-chlorphenyl)benzenbutanol;
- 35 4-brom- β -(4-bromphenyl)benzenbutanol;
- β -[2-(4-bromphenoxy)ethyl]-2,4-dichlorbenzenethanol;
- 2,4-dichlor- β -[3-(3,5-dichlorphenoxy)propyl]benzenethanol;
- β -[3-(2-bromphenoxy)propyl]-2,4-dichlorbenzenethanol;

2,4-dichlor- β -[3-(4-chlor-3-methylphenoxy)propyl]benzenethanol;

2,4-dichlor- β -[3-(4-chlor-2-methylphenoxy)propyl]benzenethanol;

2,4-dichlor- β -[3-(2-naphthalenyloxy)propyl]benzenethanol;

β -[3-(2-brom-4-methylphenoxy)propyl]-2,4-dichlorbenzenethanol;

5 2,4-dichlor- β -[3-(2,4-dichlor-6-methylphenoxy)propyl]benzenethanol;

2,4-dichlor- β -[3-(3-chlor-[1,1'-biphenyl]-4-yloxy)propyl]-
benzenethanol, og

2,4-dichlor- β -[3-(2,4,6-tribromphenoxy)propyl]benzenethanol.

10 Eksempel 16

Til en omrørt og afkølet (isbad) blanding af 22 dele 2,4-dichlor- β -(cyclohexylmethyl)benzenethanol og 50 dele pyridin sættes dråbevis 8,8 dele methansulfonylchlorid. Efter endt tilsætning fortsættes omrøringen i 3 timer ved stuetemperatur. Reaktionsblandingen hældes på vand, og
15 produktet ekstraheres to gange med trichlormethan. De forenede ekstrakter vaskes to gange med en fortyndet saltsyreopløsning og en gang med vand, tørres, filtreres og inddampes. Remanensen krystalliseres fra 2,2'-oxybispropan til opnåelse af 16,5 dele 3-cyclohexyl-2-(2,4-dichlorphenyl)propylmethansulfonat, smeltepunkt 105,1°C.

20

Eksempel 17

Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 16 fremstilles de følgende methansulfonater, idet man går ud fra de tilsvarende alkoholer:

2-(2,4-dichlorphenyl)-5-hexenylmethansulfonat som en remanens;

25 2-(2,4-dichlorphenyl)propylmethansulfonat som en remanens;

2-(2,4-dichlorphenyl)-3-methylbutylmethansulfonat som en remanens;

2-(2,4-dibromphenyl)hexylmethansulfonat som en remanens;

4-cyclopentyl-2-(2,4-dichlorphenyl)butylmethansulfonat, smeltepunkt
65,4°C;

30 4-cyclohexyl-2-(2,4-dichlorphenyl)butylmethansulfonat, smeltepunkt
44,4°C;

3-([1,1'-biphenyl]-4-yl)-2-(2,4-dichlorphenyl)propylmethansulfonat
som en olieagtig remanens;

2,4-bis(2,4-dichlorphenyl)butylmethansulfonat som en olieagtig re-
35 manens;

2,4-bis(4-chlorphenyl)butylmethansulfonat som en remanens;

4-(4-chlorphenyl)-2-(4-methylphenyl)butylmethansulfonat som en
olieagtig remanens;

2-(4-bromphenyl)-4-(2-methoxyphenyl)butylmethansulfonat som en olieagtig remanens;

2-(4-bromphenyl)-4-(4-chlorphenyl)butylmethansulfonat som en olieagtig remanens;

5 4-(4-chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)butylmethansulfonat som en olieagtig remanens;

2-(4-fluorphenyl)-4-(4-methylphenyl)butylmethansulfonat som en olieagtig remanens, og

10 4-(4-bromphenyl)-2-(2-chlorphenyl)butylmethansulfonat som en olieagtig remanens.

Eksempel 18

En blanding af 30,4 dele β -[2-(4-bromphenoxy)ethyl]-2,4-dichlorbenzenethanol, 11,5 dele methansulfonylchlorid, 100 dele pyridin og 70 dele
 15 2,2'-oxybispropan omrøres natten over ved stuetemperatur. Reaktionsblandingen hældes på vand, og produktet ekstraheres to gange med 2,2'-oxybispropan. De forenede ekstrakter vaskes successivt med en fortyndet saltsyreopløsning og to gange med vand, tørres, filtreres og inddampes til opnåelse af 34 dele 4-(4-bromphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)butylmethansulfonat som en remanens.
 20

Eksempel 19

Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 18 fremstilles de følgende methansulfonater, idet man går ud fra de tilsvarende alkoholer:

25 5-(3,5-dichlorphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentylmethansulfonat som en remanens;

5-(2-bromphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentylmethansulfonat som en remanens;

30 5-(4-chlor-3-methylphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentylmethansulfonat som en remanens;

2-(2,4-dichlorphenyl)-5-(2-naphthalenyloxy)pentylmethansulfonat som en remanens;

5-(4-chlor-2-methylphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentylmethansulfonat som en remanens;

35 5-(2-brom-4-methylphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentylmethansulfonat som en olieagtig remanens;

5-(2,4-dichlor-6-methylphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentylmethansulfonat som en remanens;

5-(2-chlor-[1,1'-biphenyl]-4-yloxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentylmethansulfonat som en remanens;

2,4-bis(4-bromphenyl)butylmethansulfonat som en olieagtig remanens,
og

5 2-(2,4-dichlorphenyl)-5-(2,4,6-tribromphenoxy)pentylmethansulfonat
som en remanens.

Eksempel 20

Til en omrørt blanding af 14 dele 1H-1,2,4-triazol og 225 dele N,N-
10 dimethylformamid sættes 6,2 dele af en 78% natriumhydriddispersion. Når
skumningen er ophørt tilsættes der 19,5 dele 2-(2,4-dichlorphenyl)propylmethansulfonat, og omrøringen fortsættes i 6 timer ved tilbagesvaling. Reaktionsblandingen afkøles, hældes på vand, og produktet ekstraheres to gange med 2,2'-oxybispropan. De forenede ekstrakter vaskes med
15 vand, tørres, filtreres og inddampes. Remanensen krystalliseres fra petroleumsether. Produktet frafiltreres og tørres, hvilket giver 10,2 dele (58%) 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)propyl]-1H-1,2,4-triazol, smeltepunkt 79,5°C.

20 Eksempel 21

Til en omrørt blanding af 16 dele 1H-1,2,4-triazol i 225 dele N,N-dimethylformamid sættes 6,8 dele af en 78% natriumhydriddispersion, og det hele omrøres til skumning er ophørt. Der tilsættes dernæst 23,5 dele 2-(2,4-dichlorphenyl)-3-methylbutylmethansulfonat, og omrøringen fortsættes i 24 timer ved tilbagesvalingstemperatur. Reaktionsblandingen afkøles og hældes på vand. Produktet ekstraheres to gange med 2,2'-oxybispropan. De forenede ekstrakter udvaskes med vand, tørres, filtreres og inddampes. Remanensen renses ved søjlekromatografi over silicagel under anvendelse af en blanding af trichlormethan og methanol (98:2 efter volumen) som elueringsmiddel. De rene fraktioner opsamles, og elueringsmidlet afdampes. Remanensen omdannes til nitratsaltet i 2,2'-oxybispropan. Saltet frafiltreres og krystalliseres fra en blanding af 4-methyl-2-pentanone og 2,2'-oxybispropan, hvilket giver 18,4 dele (70%) 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-3-methylbutyl]-1H-1,2,4-triazolnitrat, smeltepunkt
35 147,1°C.

Eksempel 22

Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 21 og anvende en ækvivalent

mængde af et passende methansulfonat i stedet for 2-(2,4-dichlorphenyl)-3-methylbutylmethansulfonat, anvendt deri, fremstilles de følgende triazoler og triazolnitratsalte:

- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazol, smeltepunkt
5 70,2°C;
- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)pentyl]-1H-1,2,4-triazol, smeltepunkt
62,7°C;
- 1-[2-(2,4-dibromphenyl)hexyl]-1H-1,2,4-triazolnitrat, smeltepunkt
141,7°C;
- 10 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-3-methylpentyl]-1H-1,2,4-triazolnitrat,
smeltepunkt 116,6°C;
- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-4-methylpentyl]-1H-1,2,4-triazolnitrat,
smeltepunkt 146,8°C;
- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)heptyl]-1H-1,2,4-triazolnitrat, smeltepunkt
15 144,6°C;
- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)decyl]-1H-1,2,4-triazolnitrat, smeltepunkt
116,6°C;
- 1-[2-cyclopentyl-2-(2,4-dichlorphenyl)ethyl]-1H-1,2,4-triazolni-
trat, smeltepunkt 149,2°C;
- 20 1-[2-cyclohexyl-2-(2,4-dichlorphenyl)ethyl]-1H-1,2,4-triazol, smel-
tepunkt 79,2°C;
- 1-[3-cyclohexyl-2-(2,4-dichlorphenyl)propyl]-1H-1,2,4-triazolnitrat
hemihydrat, smeltepunkt 124,3°C;
- 1-[4-cyclohexyl-2-(2,4-dichlorphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazol, smel-
25 tepunkt 96,5°C;
- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-4-pentenyl]-1H-1,2,4-triazolnitrat, smel-
tepunkt 139,7°C, og
- 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-5-hexenyl]-1H-1,2,4-triazolmononitrat,
smeltepunkt 114,8°C.

30

Eksempel 23

Til en omrørt blanding af 3,8 dele af en 78% natriumhydriddispersion og 90 dele N,N-dimethylformamid sættes dråbevis en opløsning af 21 dele 2,4-bis(4-chlorphenyl)butylmethansulfonat i 45 dele N,N-dimethyl-
35 formamid. Efter omrøring i 15 minutter ved stuetemperatur, tilsættes der en opløsning af 7,6 dele 1H-1,2,4,-triazol i 45 dele N,N-dimethylformamid. Det hele opvarmes langsomt til 100°C, og omrøringen fortsættes i 2 timer ved 100°C. Reaktionsblandingen hældes på vand, og produktet eks-

traheres med 1,1'-oxybisethan. Ekstrakten vaskes med vand, tørres, filtreres og indampes. Den olieagtige remanens renses ved søjlekromatografi over silicagel under anvendelse af en blanding af trichlormethan og methanol (97,5:2,5 efter volumen) som elueringsmiddel. De rene fraktioner opsamles, og elueringsmidlet afdampes. Den olieagtige remanens omdannes til hydrochloridsaltet i 2,2'-oxybispropan. Saltet frafiltreres og krystalliseres fra en blanding af methanol og 2,2'-oxybispropan, hvilket giver 7 dele (32,5%) 1-[2,4-bis(4-chlorphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazol-hydrochlorid, smeltepunkt 173,4°C.

10

Eksempel 24

Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 23 og anvende en ækvivalent mængde af et passende methansulfonat i stedet for 2,4-bis(4-chlorphenyl)butylmethansulfonat fremstilledes de følgende triazoler og triazolhydrochloridsalte:

15

1-[3-([1,1'-biphenyl]-4-yl)-2-(2,4-dichlorphenyl)propyl]-1,2,4-triazolhydrochlorid, smeltepunkt 175,5°C;

1-[4-(4-chlorphenyl)-2-(4-methylphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazolhydrochlorid, smeltepunkt 170°C;

20 1-[2-(4-bromphenyl)-4-(2-methoxyphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazolhydrochlorid, smeltepunkt 153,2°C;

1-[2-(4-bromphenyl)-4-(4-chlorphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazol, smeltepunkt 87,6°C;

25 1-[4-(4-chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazolhydrochlorid, smeltepunkt 171,8°C;

1-[2-(4-fluorphenyl)-4-(4-methylphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazolhydrochlorid, smeltepunkt 128,6°C;

1-[4-(4-bromphenyl)-2-(2-chlorphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazolhydrochlorid, smeltepunkt 142,6°C, og

30 1-[2,4-bis(4-bromphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazolhydrochlorid, smeltepunkt 163°C.

Eksempel 25

En blanding af 6,9 dele 1H-1,2,4-triazol, 3,4 dele af en 78% natriumhydriddispersion og 90 dele N,N-dimethylformamid omrøres i 10 minutter ved stuetemperatur. Der tilsættes dernæst en opløsning af 19,9 dele 5-(2-brom-4-methylphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentylmethansulfonat i 45 dele N,N-dimethylformamid. Omrøringen fortsættes i 2 timer ved 100°C.

Reaktionsblandingen får lov til at afkøle til stuetemperatur og hældes på vand. Produktet ekstraheres to gange med 1,1'-oxybisethan. De forenede ekstrakter vaskes med vand og gøres sure med koncentreret salpetersyreopløsning. Det dannede nitratsalt frafiltreres og omkrystalliseres fra en blanding af acetonitril og 2,2'-oxybispropan, hvilket giver 13,3 dele (64%) 1-[5-(2-brom-4-methylphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentyl]-1H-1,2,4-triazolnitrát, smeltepunkt 119,6°C.

Eksempel 26

10 Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 25 fremstilles de følgende triazolnitratsalte, idet man går ud fra 1H-1,2,4-triazol og et passende methansulfonat:

1-[5-(3,5-dichlorphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentyl]-1H-1,2,4-triazolnitrát, smeltepunkt 145,3°C;

15 1-[4-(4-bromphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazolnitrát, smeltepunkt 144,6°C;

1-[5-(2-bromphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentyl]-1H-1,2,4-triazolnitrát, smeltepunkt 123,2°C;

20 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-5-(2-naphthalenyloxy)pentyl]-1H-1,2,4-triazolnitrát, smeltepunkt 136,8°C;

1-[5-(4-chlor-3-methylphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentyl]-1H-1,2,4-triazolnitrát, smeltepunkt 140°C;

1-[5-(4-chlor-2-methylphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentyl]-1H-1,2,4-triazolnitrát, smeltepunkt 123,1°C;

25 1-[5-(2,4-dichlor-6-methylphenoxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentyl]-1H-1,2,4-triazolnitrát, smeltepunkt 153,4°C;

1-[5-(3-chlor-[1,1'-biphenyl]-4-yloxy)-2-(2,4-dichlorphenyl)pentyl]-1H-1,2,4-triazolnitrát, smeltepunkt 135,3°C, og

30 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-5-(2,4,6-tribromphenoxy)pentyl]-1H-1,2,4-triazolnitrát, smeltepunkt 166,5°C.

Eksempel 27

Til en omrørt natriummethoxidopløsning fremstillet i forvejen ud fra 3,9 dele natrium i 40 dele methanol, sættes en blanding af 12 dele 35 1H-1,2,4-triazol og 225 dele N,N-dimethylformamid. Methanolen afdestilleres til en indre temperatur på 150°C nås. Efter afkøling til 100°C tilsættes der 18,5 dele 2-(2,4-dichlorphenyl)hexylmethansulfonat og omrøring ved 100°C fortsættes i 2 timer. Reaktionsblandingen afkøles,

hældes på vand, og produktet ekstraheres tre gange med 2,2'-oxybispropan. De forenede ekstrakter vaskes med vand, tørres, filtreres og indampes. Remanensen renses ved søjlekromatografi over silicagel under anvendelse af trichlormethan som elueringsmiddel. De rene fraktioner op-

5 samles, og elueringsmidlet afdampes. Remanensen omdannes til nitratsaltet i 2,2'-oxybispropan og petroleumsether. Saltet frafiltreres og omkrystalliseres fra en blanding af 2-propanon, 2,2'-oxybispropan og petroleumsether, hvilket giver 11,6 dele (56%) 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)hexyl]-1H-1,2,4-triazolnitrat, smeltepunkt 128,3°C.

10

Eksempel 28

Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 27 fremstilles følgende forbindelser:

1-[4-cyclopentyl-2-(2,4-dichlorphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazol,
15 smeltepunkt 71°C, ved omsætning af 1H-1,2,4-triazol med 4-cyclopentyl-(2,4-dichlorphenyl)butylmethansulfonat, og

1-[2,4-bis(2,4-dichlorphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazolhydrochlorid, smeltepunkt 158,7°C, ved omsætning af 1H-1,2,4-triazol med 2,4-bis(2,4-dichlorphenyl)butylmethansulfonat.

20

Eksempel 29

Til en omrørt natriummethoxidopløsning fremstillet ud fra 1,6 dele natrium i 56 dele methanol sættes 4,8 dele 1H-1,2,4-triazol. 40 dele methanol afdestilleres ved normalt tryk. Efter tilsætning af 80 dele 4-methyl-2-pentanon afdestilleres yderligere 28 dele af opløsningsmidlet.

25 Der tilsættes dernæst 22 dele 3-(4-chlorphenyl)-2-(2,4-dichlorphenyl)-propylmethansulfonat og 90 dele N,N-dimethylformamid, og det hele omrøres og tilbagesvales natten over. Reaktionsblandingen får lov at afkøle til stuetemperatur og hældes på vand. Produktet ekstraheres to gange med

30 2,2'-oxybispropan. De forenede ekstrakter vaskes to gange med vand, og et overskud af en koncentreret salpetersyreopløsning tilsættes. Det dannede nitratsalt frafiltreres og omkrystalliseres fra 4-methyl-2-pentanon, hvilket giver 6,6 dele (27%) 1-[3-(4-chlorphenyl)-2-(2,4-dichlorphenyl)propyl]-1H-1,2,4-triazolnitrat, smeltepunkt 174,8°C.

35

Eksempel 30

Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 29 fremstilles der 1-[3-(2-bromphenyl)-2-(2,4-dichlorphenyl)propyl]-1H-1,2,4-triazolnitrat, smelte-

punkt 168,4°C, ved omsætning af 1H-1,2,4-triazol med 3-(2-bromphenyl)-2-(2,4-dichlorphenyl)propylmethansulfonat.

Eksempel 31

- 5 Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 10 fremstilles methyl-2,4-dibrombenzenacetat, kogepunkt 105-110°C ved 0,1 mm tryk, idet man går ud fra 2,4-dibrombenzenacetonitril.

Eksempel 32

- 10 Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 13 og anvende ækvivalente mængder af passende udgangsmaterialer fremstilles følgende forbindelser:
 2,4-dibrom- β -(2-methylpropyl)benzenethanol som en remanens;
 2,4-dibrom- β -(1-methylethyl)benzenethanol som en remanens, og
 2,4-dibrom- β -(1-methylpropyl)benzenethanol som en remanens.

15

Eksempel 33

Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 16 og anvende ækvivalente mængder af passende udgangsmaterialer fremstilles:

- 20 [2-(2,4-dibromphenyl)-4-methylpentyl]methansulfonat som en remanens;
 [2-(2,4-dibromphenyl)-3-methylbutyl]methansulfonat som en remanens,
 og
 [2-(2,4-dibromphenyl)-3-methylpentyl]methansulfonat som en remanens.

25

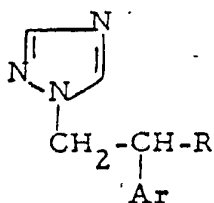
Eksempel 34

Ved at følge fremgangsmåden i eksempel 21 og anvende ækvivalente mængder af passende udgangsmaterialer opnås følgende forbindelser:

- 1-[2-(2,4-dibromphenyl)-4-methylpentyl]-1H-1,2,4-triazolmononitrat,
 30 smeltepunkt 153,6°C;
 1-[2-(2,4-dibromphenyl)-3-methylbutyl]-1H-1,2,4-triazolmononitrat,
 smeltepunkt 142,9°C;
 1-{2-(4-chlorphenyl)-2-(1-methylethoxy)ethyl}-1H-1,2,4-triazolmononitrat, smeltepunkt 135,3°C;
 35 1-{2-(2,4-dichlorphenyl)-2-(1-methylethoxy)ethyl}-1H-1,2,4-triazolmononitrat, smeltepunkt 146,1°C, og
 1-[2-(2,4-dibromphenyl)-3-methylpentyl]-1H-1,2,4-triazolmononitrat, smeltepunkt 131,8°C.

PATENTKRAV

1. 1H-1,2,4-triazolderivater med antifungal og plantevækstregulerende virkning, KENDETEGNET ved, AT de har den almene formel:



hvor Ar betegner phenyl, mono-, di- eller trihalogenphenyl, lavere alkylphenyl, lavere alkoxyphenyl, nitrophenyl, cyanophenyl eller trifluor-methylphenyl, og

R betegner alkyl med fra 1 til 10 carbonatomer, cycloalkyl, cycloalkyl-lavere alkyl, lavere alkenyl, aryl-lavere alkyl eller aryloxy-lavere alkyl, idet aryl betegner phenyl, naphthalenyl eller substitueret phenyl, hvor den substituerede phenylgruppe er phenyl med fra 1 til 3 substituent, uafhængigt udvalgt blandt halogen, lavere alkyl, lavere alkyloxy, cyano, nitro og phenyl, med den forudsætning, at kun én af substituenterne kan være cyano, nitro eller phenyl, når der er mere end én substituent til stede, eller fysiologisk acceptable syreadditionssalte deraf.

2. Kemisk forbindelse ifølge krav 1, KENDETEGNET ved, AT den er 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-3-methylbutyl]-1H-1,2,4-triazol eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf.

3. Kemisk forbindelse ifølge krav 1, KENDETEGNET ved, AT den er 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-3-methylpentyl]-1H-1,2,4-triazol eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf.

4. Kemisk forbindelse ifølge krav 1, KENDETEGNET ved, AT den er 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-4-methylpentyl]-1H-1,2,4-triazol eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf.

5. Kemisk forbindelse ifølge krav 1, KENDETEGNET ved, AT den er 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-hexyl]-1H-1,2,4-triazol eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf.

6. Kemisk forbindelse ifølge krav 1, KENDETEGNET ved, AT den er 1-[4-(4-chlorphenyl)-2-(4-methylphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazol eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf.

5

7. Kemisk forbindelse ifølge krav 1, KENDETEGNET ved, AT den er 1-[4-(4-chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazol eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf.

10

8. Kemisk forbindelse ifølge krav 1, KENDETEGNET ved, AT den er 1-[2-(2,4-dibromphenyl)hexyl]-1H-1,2,4-triazol eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf.

9. Kemisk forbindelse ifølge krav 1, KENDETEGNET ved, AT den er 15 1-[2-(4-fluorphenyl)-4-(4-methylphenyl)butyl]-1H-1,2,4-triazol eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf.

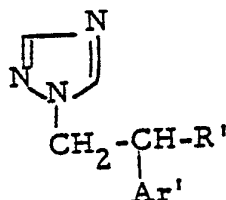
10. Kemisk forbindelse ifølge krav 1, KENDETEGNET ved, AT den er 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)heptyl]-1H-1,2,4-triazol eller et fysiologisk 20 acceptabelt syreadditionssalt deraf.

11. Kemisk forbindelse ifølge krav 1, KENDETEGNET ved, AT den er 1-[2-cyclohexyl-2-(2,4-dichlorphenyl)ethyl]-1H-1,2,4-triazol eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf.

25

12. Kemisk forbindelse ifølge krav 1, KENDETEGNET ved, AT den er et 1H-1,2,4-triazolderivat med den almene formel

30



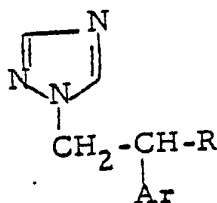
eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf, hvori

35 Ar' betegner dichlorphenyl eller dibromphenyl, og

R' betegner alkyl med fra 1 til 8 carbonatomer, cycloalkyl eller 2-propenyl.

13. Præparat til bekæmpelse af fungi, KENDETEGNET ved, AT det omfatter et inert bærermateriale og som aktiv komponent en effektiv antifungal mængde af en forbindelse i form af et 1H-1,2,4-triazolderivat med den almene formel

5



10 eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf, hvori Ar betegner phenyl, mono-, di- eller trihalogenphenyl, lavere alkylphenyl, lavere alkoxyphenyl, nitrophenyl, cyanophenyl eller trifluormethylphenyl, og

R betegner alkyl med fra 1 til 10 carbonatomer, cycloalkyl, cycloalkyl-lavere alkyl, lavere alkenyl, aryl-lavere alkyl eller aryloxy-lavere alkyl, idet aryl betegner phenyl, naphthalenyl eller substitueret phenyl, hvor den substituerede phenylgruppe er phenyl med fra 1 til 3 substituent, uafhængigt udvalgt blandt halogen, lavere alkyl, lavere alkyloxy, cyano, nitro og phenyl, med den forudsætning, at kun én af
20 substituenterne kan være cyano, nitro eller phenyl, når der er mere end én substituent.

14. Præparat ifølge krav 13, KENDETEGNET ved, AT det som aktiv komponent indeholder 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)-3-methylbutyl]-1H-1,2,4-triazol eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf.
25

15. Præparat ifølge krav 13, KENDETEGNET ved, AT det som aktiv komponent indeholder 1-[2-(2,4-dichlorphenyl)hexyl]-1H-1,2,4-triazol eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf.

30

16. Præparat ifølge krav 13, KENDETEGNET ved, AT det som aktiv komponent indeholder 1-[2-cyclohexyl-2-(2,4-dichlorphenyl)ethyl]-1H-1,2,4-triazol eller et fysiologisk acceptabelt syreadditionssalt deraf.

35