

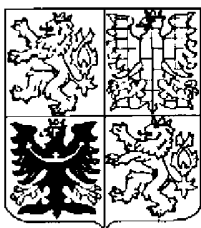
ČESKÁ
REPUBLIKA

ZVEŘEJNĚNÁ PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

(21) 904-93

(13) A3

(19)



(12)

5(51)

C 07 D 239/92

A 01 N 47/36

A 01 N 43/54

(22) 14.05.93

(32) 01.06.92

(31) 92/891528

(33) US

(40) 16.02.94

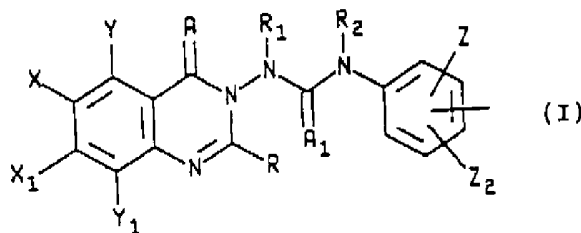
ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(71) American Cyanamid Company, Stamford, Connecticut, US;

(72) Takasugi James Jan, Horsham, Pennsylvania, US;
Neypes Millord Victor Ty, Laguna, PH;
Evans Lynn Susan, Langhorne, Pennsylvania, US;
Kohls Clint Louis, Philadelphia, Pennsylvania, US;
Witucki Laurie Ann, Stockton, New Jersey, US;

(54) **Fungicidní činidla na bázi 1-aryl-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močoviny**

(57) Řešení se týká fungicidně účinných 1-aryl-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl) močoviny kde X a X₁ je nezávisle H nebo F; Y a Y₁ je nezávisle H, halogen, alkyl s 1 až 4 atomy C, který je popř. substituován jedním nebo více atomy halogenu nebo fenyl, nitro, kyano, alkoxykarbonyl s 1 až 4 atomy C v alkoxyly, alkykarbonyloxy s 1 až 4 atomy C v alkyly nebo fenylkarbonyloxy; R je atom H, A₂R₃ nebo alkyl s 1 až 4 atomy C, který je popř. substituován jedním nebo více atomy halogenu; R₃ je atom H, alkyl s 1 až 4 atomy C nebo fenyl, který je popř. substituován jedním nebo více atomy halogenu, alkyly s 1 až 4 atomy C nebo alkoxyly s 1 až 4 atomy C; R₁ a R₂ je nezávisle atom H nebo alkyl s 1 až 4 atomy C, který je popř. substituován jedním nebo více atomy halogenu; A, A₁ a A₂ je nezávisle vždy O nebo S; Z, Z₁ a Z₂ je nezávisle vždy atom H, atom halogenu, alkyl s 1 až 4 atomy C, který je popř. substituován jedním nebo více atomy halogenu, alkoxy s 1 až 4 atomy C, který je popř. substituován jedním nebo více atomy halogenu, nitro, kyano, hydroxy, skupinu R₄S(O)_n, fenyl, fenoxo nebo alkykarbonyl a 1 až 4 atomy C v alkyly; za předpokladu, že v polohách 2 až 6 fenylového kruhu mohou být přítomny pouze atomy H nebo fluoru; R₄ je alkyl s 1 až 4 atomy C, který je popř. substituován jedním nebo více atomy halogenu; a n je 0, 1 nebo 2.



Fungicidní činidla na bázi 1-aryl-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)močoviny

Oblast techniky

Vynález se týká 1-aryl-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)močovinných sloučenin, které jsou vysoce účinné při potlačování fytopatogenních fungálních zamoření agronomických plodin, jak v průběhu růstu, tak po sklizni a při prevenci před takovými zamořeními.

Fytopatogenní houby způsobují mnoho chorob, přičemž infikují a ničí různé agronomické plodiny. Obzvláště ničivý účinek mají choroby typu skvrnitosti listů, jako je skvrnitost banánovníku (způsobená houbou *Mycosphaerella fijiensis*), cercosporióza řepy cukrové (způsobená houbou *Cercospora beticola*) a skvrnitost podzemnice olejné (způsobená houbou *Cercosporidium personatum*).

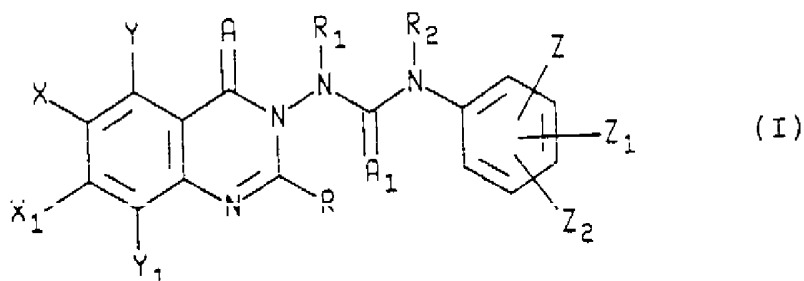
Úkolem tohoto vynálezu bylo vyvinout způsob potlačování chorob způsobených fytopatogenními houbami, způsob prevence před těmito chorobami a způsob zlepšování stavu rostlin, které jsou těmito chorobami zasaženy, aplikací fungicidně účinného množství určitých 1-aryl-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)močovinných sloučenin.

Úkolem tohoto vynálezu bylo také zejména vyvinout způsob potlačování skvrnitosti listů, například u banánu, řepy cukrové (cercosporióza) a podzemnice olejné.

Tyto a další úkoly, které vynález řeší, jsou zřejmé z následujícího podrobného popisu.

Podstata vynálezu

Předmětem vynálezu jsou 1-aryl-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)močovinná fungicidní činidla obecného vzorce I



kde

X a X₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku nebo atom fluoru;

Y a Y₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo fenylskupinami, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, alkoxykarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylovém zbytku, alkykarbonyloxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku nebo fenylkarbonyloxyskupinu;

R představuje atom vodíku, skupinu obecného vzorce A₂R₃, kde A₂ a R₃ mají dále uvedený význam nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu;

R₃ představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu,

alkylskupinami s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxy-
skupinami s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_1 a R_2 , nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku
nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je
popřípadě substituována jedním nebo více atomy
halogenu;

A , A_1 a A_2 nezávisle představuje vždy atom kyslíku nebo atom
síry;

Z , Z_1 a Z_2 nezávisle představuje vždy atom vodíku, atom
halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která
je popřípadě substituována jedním nebo více atomy
halogenu, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,
která je popřípadě substituována jedním nebo více
atomy halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxy-
skupinu, skupinu obecného vzorce $R_4S(O)_n$, kde R_4 a
 n mají dále uvedený význam, fenylskupinu, fenoxy-
skupinu nebo alkylkarbonylskupinu s 1 až 4 atomy
uhlíku v alkylovém zbytku; za předpokladu, že v
polohách 2 a 6 fenylvého kruhu mohou být přítomny
pouze atomy vodíku nebo fluoru;

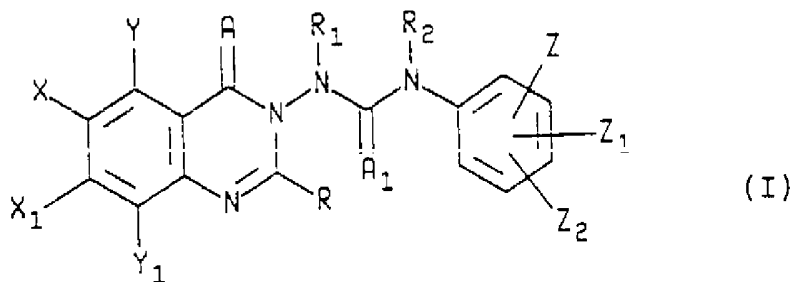
R_4 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,
která je popřípadě substituována jedním nebo více
atomy halogenu; a

n představuje celé číslo 0, 1 nebo 2.

Předmětem vynálezu jsou také prostředky na bázi sloučenin
obecného vzorce I a způsoby prevence chorob, potlačování
chorob a zlepšování stavu zamořených rostlin v případě
chorob, které jsou způsobeny fytopatogenními houbami.

Následuje podrobný popis vynálezu.

Neočekávaně se zjistilo, že určité chinazolinylové sloučeniny jsou vysoce účinnými fungicidy. 1-aryl-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovinová fungicidní činidla podle tohoto vynálezu mají strukturu odpovídající obecnému vzorci I



kde

X a X₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku nebo atom fluoru;

Y a Y₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo fenylskupinami, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, alkoxykarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylovém zbytku, alkylkarbonyloxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku nebo fenylkarbonyloxyskupinu;

R představuje atom vodíku, skupinu obecného vzorce A₂R₃, kde A₂ a R₃ mají dále uvedený význam nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu;

R₃ představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4

atomy uhlíku nebo fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkylskupinami s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxy- skupinami s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_1 a R_2 , nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu;

A , A_1 a A_2 nezávisle představuje vždy atom kyslíku nebo atom síry;

Z , Z_1 a Z_2 nezávisle představuje vždy atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atom halogenu, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxy- skupinu, skupinu obecného vzorce $R_4S(O)_n$, kde R_4 a n mají dále uvedený význam, fenylskupinu, fenoxy- skupinu nebo alkylkarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku; za předpokladu, že v polohách 2 a 6 fenylového kruhu mohou být přítomny pouze atomy vodíku nebo fluoru;

R_4 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu; a

n představuje celé číslo 0, 1 nebo 2.

S překvapením se nyní zjistilo, že sloučeniny obecného vzorce I, podle tohoto vynálezu, jsou zejména užitečné při potlačování, prevenci nebo zlepšování stavu rostlin

v případě chorob typu skvrnitosti listů, jako je skvrnitost banánů (způsobená houbou *Mycosphaerella fijiensis*), cercosporiíza řepy cukrové (způsobená houbou *Cercospora beticola*) a skvrnitost podzemnice olejné (způsobená houbou *Cercosporidium personatum*).

Přednostními sloučeninami podle vynálezu, které vykazují obzvláště výrazný fungicidní účinek, jsou ze sloučenin obecného vzorce I ty sloučeniny, v nichž

X a X₁ představuje atom vodíku;

Y a Y₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku, atom halogenu;

R představuje atom vodíku nebo skupinu obecného vzorce A₂R₃, kde A₂ a R₃ mají dále uvedený význam;

R₃ představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R₁ a R₂ představuje atom vodíku;

A představuje atom kyslíku;

A₁ a A₂ nezávisle představuje vždy atom kyslíku nebo atom síry;

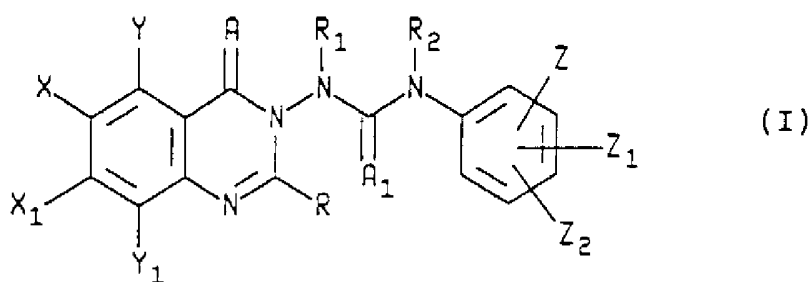
Z představuje atom vodíku; a

Z₁ a Z₂ nezávisle představuje vždy atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více

atomy halogenu.

Jako příklady výše uvedených halogenů je možno uvést fluor, chlor, brom a jod.

Předmětem vynálezu jsou také nové 1-aryl-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)močovinné sloučeniny obecného vzorce I



kde

X a X₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku nebo atom fluoru;

Y a Y₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo fenylskupinami, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, alkoxykarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylovém zbytku, alkylkarbonyloxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku nebo fenylkarbonyloxyskupinu;

R představuje atom vodíku nebo skupinu obecného vzorce A₂R₃, kde A₂ a R₃ mají dále uvedený význam;

R₃ představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo fenylskupinu, která je popřípadě

substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkylskupinami s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxy- skupinami s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_1 a R_2 , nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu;

A , A_1 a A_2 nezávisle představuje vždy atom kyslíku nebo atom síry;

Z , Z_1 a Z_2 nezávisle představuje vždy atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkoxy- skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxy- skupinu, skupinu obecného vzorce $R_4S(O)_n$, kde R_4 a n mají dále uvedený význam, fenylskupinu, fenoxy- skupinu nebo alkylkarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku; za předpokladu, že v polohách 2 a 6 fenylvého kruhu mohou být přítomny pouze atomy vodíku nebo fluoru;

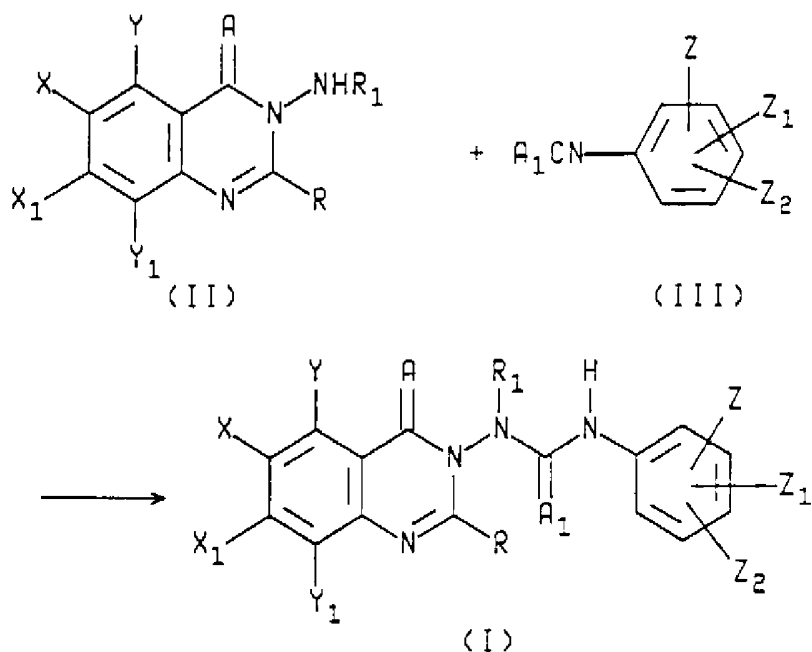
R_4 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu; a

n představuje celé číslo 0, 1 nebo 2,

přičemž když X , X_1 , Y , Y_1 , R , R_1 a R_2 představuje atom vodíku, A představuje atom kyslíku a A_1 představuje atom síry, potom alespoň jeden ze symbolů Z , Z_1 nebo Z_2 představuje jiný substituent než atom vodíku.

Určité sloučeniny obecného vzorce I je možno připravovat způsobem, který je znázorněn v reakčním schématu I.

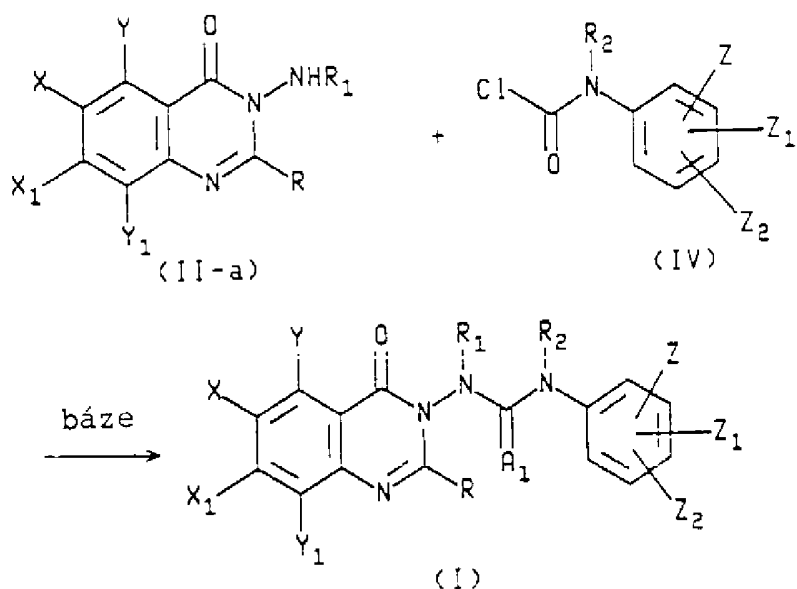
R e a k č n í s c h e m a I



Příslušným způsobem substituovaná sloučenina obecného vzorce II se nechá reagovat s alespoň jedním molárním ekvivalentem substituovaného kyanátu obecného vzorce III, za přítomnosti inertního organického rozpouštědla, jako jsou chlorované uhlovodíky, přednostně při teplotě v rozmezí od asi 15 do asi 100 °C, za vzniku požadované sloučeniny obecného vzorce I.

Jiné sloučeniny obecného vzorce I, v nichž R₁ a R₂ představuje vždy alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, se mohou připravovat způsobem, který je znázorněn v následujícím reakčním schématu II.

R e a k č n í s c h e m a I I



Příslušným způsobem substituovaný 3-alkylamino-4(3H)-chinazolinon s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku, jehož struktura je popsána obecným vzorcem II-a, se nechá reagovat s N-alkylkarbaniloylchloridem obecného vzorce IV s 1 až 4 atomy v alkylovém zbytku, za přítomnosti báze, jako je pyridin a v inertním organickém rozpouštědle, jako jsou chlorované uhlovodíky, přednostně při teplotě v rozmezí od asi 15 do asi 100 °C, za vzniku požadované sloučeniny obecného vzorce I, kde X, X₁, Y, Y₁, R, Z, Z₁ a Z₂ mají význam uvedený výše u obecného vzorce I a každý ze symbolů R₁ a R₂ představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku. [Výchozí sloučeniny obecného vzorce II jsou například popsány v *Journal of Heterocyclic Chemistry*, 21, str. 1817 až 1824 (1984); *Journal of Organic Chemistry*, 42, str. 161 až 162 (1977); *Journal of Heterocyclic Chemistry*, 19, str. 117 (1982); a *Journal für praktische Chemie*, 31, str. 140 až 148 (1966).] Sloučeniny obecného vzorce IV a III jsou popsány v *Preparative Organic Chemistry*, red. G. Hilgetag a A. Martini (New York: John Wiley and Sons., 1972), str. 269 a 472 až 473.

1-aryl-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)močoviny sloučeniny podle vynálezu jsou účinné při prevenci, potlačování nebo zlepšování stavu rostlin před nebo v případě zasažení fytopatogenními houbami. Sloučeniny obecného vzorce I jsou zejména účinné při prevenci chorob, potlačování chorob nebo zlepšování stavu rostlin v případě chorob typu skvrnitosti listů, jako je skvrnitost banánů (způsobená houbou *Mycosphaerella fijiensis*), cercosporiáza řepy cukrové (způsobená houbou *Cercospora beticola*) a skvrnitost podzemnice olejné (způsobená houbou *Cercosporidium personatum*).

1-aryl-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)močoviny sloučeniny podle vynálezu jsou rovněž účinné při potlačování nebo omezování růstu fytopatogenních hub za přítomnosti rostoucích nebo sklizených plodin, když se na tyto plodiny aplikují ve fungicidně účinném množství. Sloučeniny obecného vzorce I podle tohoto vynálezu jsou obzvláště užitečné při potlačování nebo omezování růstu fytopatogenních hub, jako je *Mycosphaerella fijiensis*, *Cercospora beticola* a *Cercosporidium personatum* na rostlinách banánu, cukrovky a podzemnice olejné.

Předmětem vynálezu jsou také prostředky na bázi výše popsaných sloučenin, které jsou užitečné jako fungicidní prostředky. Množství sloučeniny podle vynálezu, které bude účinné jako fungicid, se bude poněkud měnit v závislosti na virulenci cílové houby, prostředí, v němž se ošetřování provádí apod. Prostředky podle vynálezu obvykle obsahují asi 1 až asi 50 % hmotnostních, přednostně asi 10 až 30 % hmotnostních sloučeniny obecného vzorce I dispergované v kapalném nosiči a při aplikaci na rostliny, semena, hlízy, na půdu, v níž rostou, nebo do závlahové vody účinně chrání rostlinu, semena nebo hlízy před zamořením houbami a před chorobami, které jsou těmito houbami způsobovány.

Sloučeniny obecného vzorce I jsou také účinné při ochraně rostlin, semen rostlin nebo hlíz před fungálním zamořením a chorobami, které jsou těmito houbami způsobeny, při aplikaci na rostliny, semena rostlin nebo hlízy v množství odpovídajícím stupni ošetření v rozmezí od asi 0,015 do asi 3,0 kg/ha, přednostně od asi 0,03 do asi 2,0 kg/ha, vztaženo na účinnou přísadu. Při ochraně rostlin, semen rostlin a hlíz před fungálním zamořením a chorobami způsobenými houbami se samozřejmě může sloučenin obecného vzorce I používat i ve vyšších dávkách, jako je tomu například při aplikaci na půdu. Při aplikaci na rostliny, semena rostlin nebo hlízy však vyšších dávek obvykle není zapotřebí a takové vyšší dávky mají za následek pouze plýtvání.

Sloučeniny obecného vzorce I podle vynálezu je možno zpracovávat na emulgovatelné koncentráty, husté tekuté kapalně koncentráty (flowables) nebo smáčitelné prášky, které se, obvykle na místě použití, ředí vodou nebo jinými polárními rozpouštědly nebo olejovými nosiči a aplikují ve formě zředěného postřiku. Tyto sloučeniny je také možno zpracovávat na suché kompaktní granule, jiné granulární přípravky, popraše, poprašové koncentráty, suspenzní koncentráty, mikroemulze apod. Všechny těchto prostředků je možno používat pro ošetření semen, hlíz, půdy, vody a/nebo listů, za účelem dosažení požadované ochrany rostlin. V takových prostředcích jsou sloučeniny podle vynálezu smíseny s inertními pevnými nebo kapalnými ředidly.

Tak například, smáčitelné prášky, popraše a poprašové koncentráty je možno vyrábět rozemíláním a mísením přibližně 25 až 85 % hmotnostních sloučenin obecného vzorce I s asi 75 až asi 15 % hmotnostními pevného ředidla, jako je bentonit, infusoriová hlínka, kaolin, attapulgit apod., asi 1 až asi 5 % hmotnostních dispergačního činidla, jako je lignosulfonan

sodný a asi 1 až asi 5 % hmotnostních neiontového povrchově aktivního činidla, jako je oktylfenoxypolyethoxyethanol, nonylfenoxypolyethoxyethanol apod.

Husté tekuté kapalné koncentráty je možno vyrábět smísením přibližně 40 % hmotnostních účinné přísady s asi 2 % hmotnostními želatizačního činidla, jako je bentonit, asi 3 % hmotnostními dispergačního činidla, jako je lignosulfonan sodný, asi 1 % hmotnostním zahušťovadla, jako je polyethylenglykol a vodou.

Typické emulgovatelné koncentráty je možno vyrábět rozpuštěním 5 až asi 50 % hmotnostních účinné přísady v asi 95 až 50 % hmotnostních rozpouštědla, jako je isoforon, toluen, butylcellosolv, methylacetát, monomethylether propylenglykolu apod., přičemž v roztoku se disperguje přibližně 1 až 5 % hmotnostních neiontového povrchově aktivního činidla, jako je alkylfenoxypolyethoxyalkohol.

Pro použití se sloučeniny podle tohoto vynálezu připravují tak, že se předem určené množství prostředku, například prostředku popsaného výše, přidá k požadovanému objemu vody nebo jiného rozpouštědla, kapaliny nebo pevného nosiče a vzniklé směsi se použije buď samotné, nebo v kombinaci s alespoň jednou jinou agronomickou chemikálií, přičemž složky takové kombinace se mohou aplikovat buď postupně nebo současně.

Sloučenin podle vynálezu se s výhodou může používat ve spojení nebo v kombinaci s jinými biologickými chemikáliemi. Jako neomezující příklady takových chemikálií je možno uvést acephate, anilazine, benalaxyl, benomyl, bitertanol, směs bordeaux, carbendazim, carbofuran, carboxin, capatafol, captan, chlorothalonil, chlorpyrifos, cyproconazole, diazinon, dichloran, diethofencarb, dimethoate,

diniconazole, dithianon, dodine, edifenphos, ethoprop, fenamiphos, fenarimol, fenbuconazole, fenfuram, fenpropidin, fenpropimorph, fentin hydroxide, ferbam, flusilazole, flusulfamide, flutriafol, folpet, formothion, fosetyl, fuberidazole, guazatine, hexaconazole, imazalil, iprobenfos, iprodione, malathion, mancozeb, maneb, metalaxyl, methyl parathion, metiram, myclobutanil, nuarimol, ofurace, oxadixyl, oxycarboxin, penconazole, probenazole, prochloraz, propiconazole, pyrazophos, tebuconazole, terbufos, thiabendazole, thiophanate, thiphanate-methyl, triadimefon, triadimenol, triarimol, tricycloazole, tridemorph, triflumizole, triforine, vinclozolin, zineb apod.

Má-li se prostředků podle vynálezu používat ke kombinovanému ošetření s jinými pesticidními prostředky, mohou se příslušné prostředky používat ve vzájemné směsi nebo se mohou aplikovat postupně.

Předmětem vynálezu je také způsob prevence chorob, potlačování chorob nebo zlepšování stavu rostlin v případě chorob způsobených fytopatogenními houbami, jehož podstata spočívá v tom, že se houba uvede do styku s fungicidně účinným množstvím 1-aryl-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)močovinné sloučeniny obecného vzorce I.

Dále je předmětem vynálezu také způsob ochrany rostlin, semen rostlin nebo hlíz před zámořením houbami a před houbovými chorobami, jehož podstata spočívá v tom, že se na rostliny, semena rostlin nebo hlízy nebo na půdu nebo do vody, v níž rostliny rostou aplikuje fungicidně účinné množství 1-aryl-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)močovinné sloučeniny obecného vzorce I.

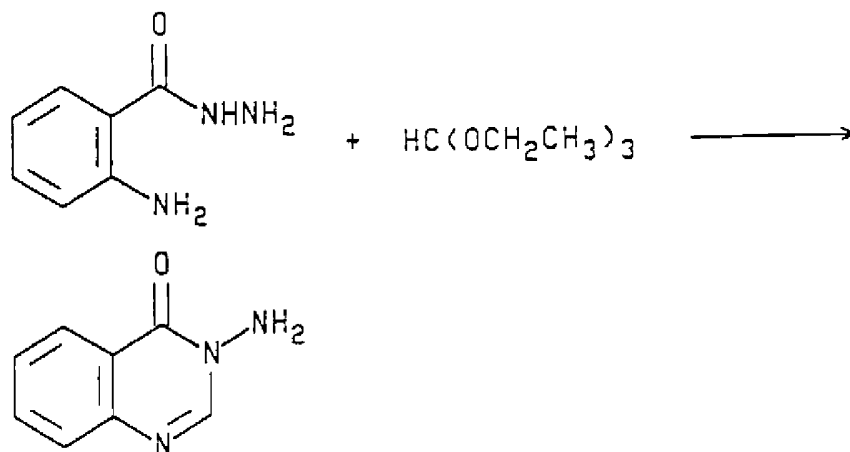
Vynález je blíže objasněn v následujících příkladech provedení. Tyto příklady mají výhradně ilustrativní

charakter a rozsah vynálezu v žádném ohledu neomezují. V příkladech jsou ilustrovány reakce znázorněné ve výše uvedených reakčních schématech a je zde popsána i výroba jiných sloučenin podle vynálezu, které nejsou specificky uvedeny výše. Pro rozsah vynálezu nejsou rozhodující příklady, nýbrž pouze patentové nároky.

Příklady provedení vynálezu

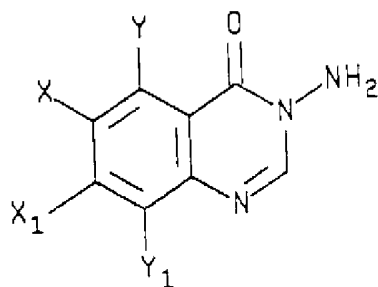
P ř í k l a d 1

Výroba 3-amino-4(3H)-chinazolinonu



Směs 2-aminobenzhydrazidu (7,16 g, 47,4 mmol) a triethyl orthoformiátu (8,3 ml, 49,9 mmol) v ethanolu se 3,5 hodiny vaří pod zpětným chladičem pod atmosférou dusíku. Směs se ochladí a přefiltruje a tak se získá titulní sloučenina ve formě bílé pevné látky (6,06 g, 79 %) o teplotě tání 209 až 210,5 °C.

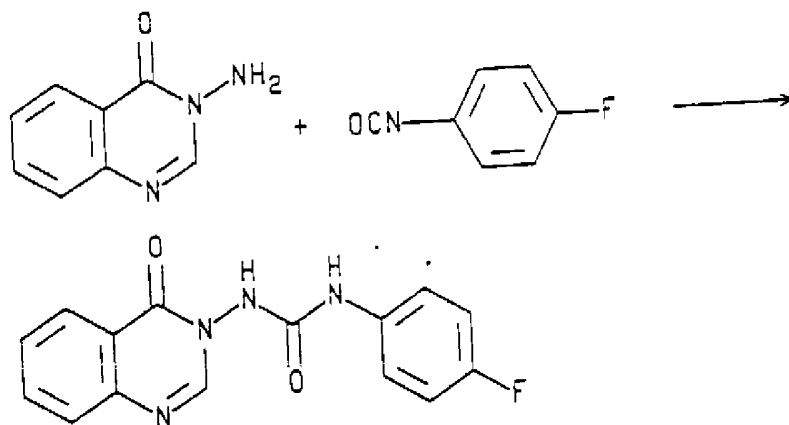
Za použití v podstatě stejného postupu a příslušným způsobem substituovaných 2-aminobenzhydrazidů se získají následující sloučeniny:



<u>Y</u>	<u>X</u>	<u>X₁</u>	<u>Y₁</u>	<u>t.t. °C</u>
H	H	H	OCH ₃	147 - 149
F	H	H	H	158 - 160
H	H	H	Cl	165 - 182
H	H	H	CH ₃	174 - 176
H	H	F	H	196 - 200
H	F	H	H	174,5 - 176,5
Cl	H	H	H	169 (rozkl.)

P ř í k l a d 2

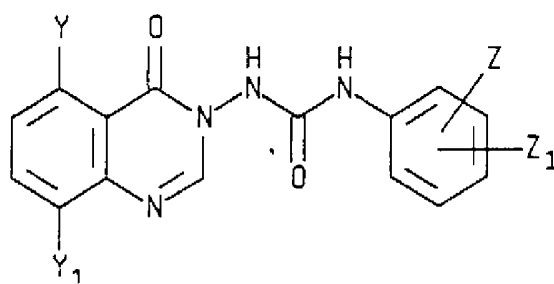
Výroba 1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(p-fluorfenyl)močoviny



4-fluorfenylisokyanát (0,74 ml, 6,51 mmol) se přidá ke směsi 3-amino-4(3H)-chinazolinonu (1,00 g, 6,21 mmol) v 1,2-dichlorethanu za varu pod zpětným chladičem. Reakční

směs se 18 hodin vaří pod zpětným chladičem, potom se ochladí na 0 °C a prefiltruje. Filtrační koláč se promyje vodou a vysuší. Získá se titulní sloučenina ve formě bílé pevné látky (1,64 g, 89 %) o teplotě tání 237 až 238 °C.

V podstatě stejným postupem se za použití příslušným způsobem substituovaných 3-amino-4-(3H)-chinazolinonů a příslušných isokyanátů získají následující sloučeniny:

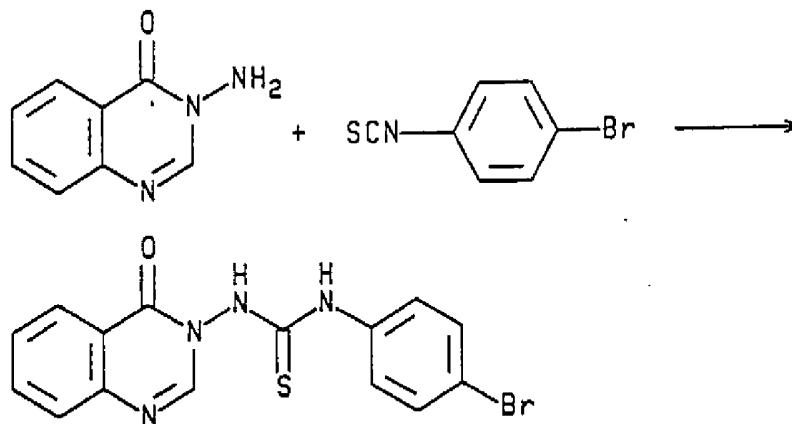


Y	Y ₁	Z	Z ₁	t.t. °C
H	H	4-Cl	H	
H	H	4-OCH ₃	H	236 - 237
H	H	4-CF ₃	H	238 - 239
H	H	H	H	219 - 220
H	H	3-Cl	4-Cl	250,5 - 251,5 (rozkl.)
H	H	4-CH ₃	H	226,5 - 227,2
H	H	3-Cl	H	234,5 - 236,5
H	H	2-F	H	216 - 217,5
H	H	4-NO ₂	H	263 - 280
H	H	3-Cl	5-Cl	257 - 259
H	H	4-OC ₆ H ₅	H	222 - 228
H	H	3-NO ₂	4-Cl	244 - 245
H	H	4-Br	H	225 - 226
H	H	3-OCH ₃	H	223 - 224
H	H	2-F	4-F	>250
H	H	2-F	6-F	240 - 241
H	H	3-CH ₃	H	219 - 220
H	H	3-Br	H	244 - 245
H	H	2-F	5-F	231 - 232

<u>Y</u>	<u>Y₁</u>	<u>Z</u>	<u>Z₁</u>	<u>t.t. °C</u>
H	H	4-OCF ₃	H	220 - 221
H	H	3-CF ₃	H	246 - 248
H	H	3-Cl	4-CH ₃	262 - 263
H	H	3-C(O)CH ₃	H	259 - 261
H	H	4-C(O)CH ₃	H	267 - 269
H	H	4-I	H	249 - 250
H	H	4-O(CH ₂) ₃ CH ₃	H	203 - 204
H	H	3-CH ₂ CH ₃	H	224 - 225
H	H	3-CF ₃	4-Cl	239 - 240
H	H	3-Cl	4-F	>260
H	H	4-C ₆ H ₅	H	246 - 248
H	H	3-CN	H	248 - 249
H	H	4-CN	H	>270
H	H	4-CH(CH ₃) ₂	H	209 - 210
H	H	3-F	H	204 - 205
H	H	4-SCH ₃	H	228 - 229
H	Cl	4-Cl	H	254 - 256
F	H	4-Cl	H	
F	H	4-Br	H	240 - 243
H	OCH ₃	4-Br	H	227 - 229
H	OCH ₃	4-Cl	H	227 - 229
H	Cl	4-Br	H	268 - 270
H	CH ₃	4-Br	H	242 - 246 (rozkl.)
H	CH ₃	4-Cl	H	251 - 254
H	H	4-SCF ₃	H	199 - 201

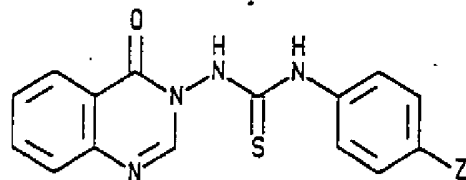
P ř í k l a d 3

Výroba 1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)-
2-thiomočoviny



4-bromfenylisothiokyanát (2,51 g, 11,72 mmol) se přidá ke směsi 3-amino-4(3H)-chinazolinonu (1,72 g, 10,66 mmol) v 1,2-dichlorethanu za varu pod zpětným chladičem a pod atmosférou dusíku. Reakční směs se 2 dny vaří pod zpětným chladičem, potom se ochladí, promyje etherem a přefiltruje. Filtrační koláč se vysuší a tak se získá titulní sloučenina ve formě bílé pevné látky (2,44 g) o teplotě tání 189 až 190 °C.

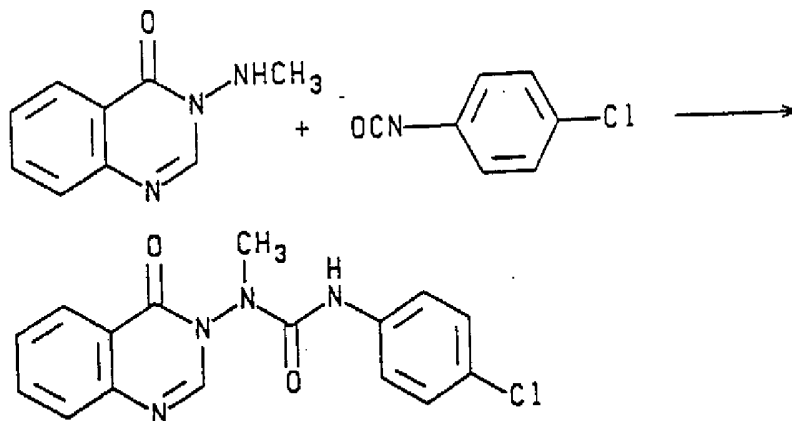
Za použití v podstatě stejného postupu, při němž se však místo 4-bromfenylisothiokyanátu použije jiných vhodných isothiokyanátů, se získají následující sloučeniny:



Z	t. t. °C
Cl	172 - 173,5
NO ₂	180 - 181
CF ₃	192 - 194
H	99 - 102

P ř í k l a d 4

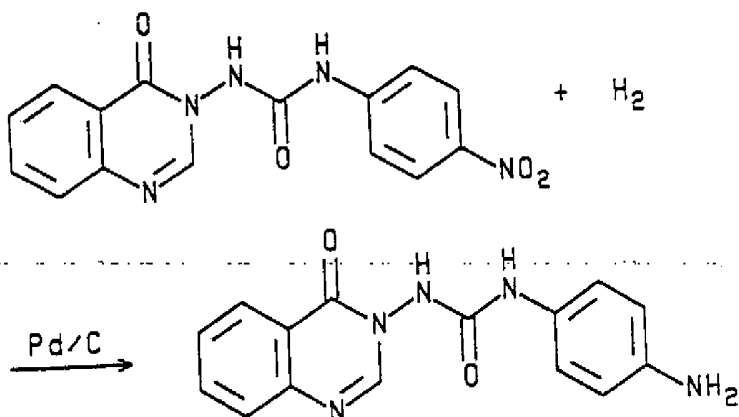
Výroba 3-(p-chlorfenyl)-1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-1-methylmočoviny



Směs 3-methylamino-4-(3H)-chinazolinonu (2,00 g, 11,4 mmol) a 4-chlorfenylisokyanátu (2,01 g, 13,1 mmol) v 1,2-dichlorethanu se 72 hodin vaří pod zpětným chladičem a potom se směs za vakua zkoncentruje a zředí etherem. Organická směs se vaří pod zpětným chladičem a potom se přefiltruje. Filtrační koláč se promyje etherem a vysuší. Získá se titulní produkt ve formě bílé pevné látky, 3,61 g (96 %) o teplotě tání 186 až 188 °C.

P ř í k l a d 5

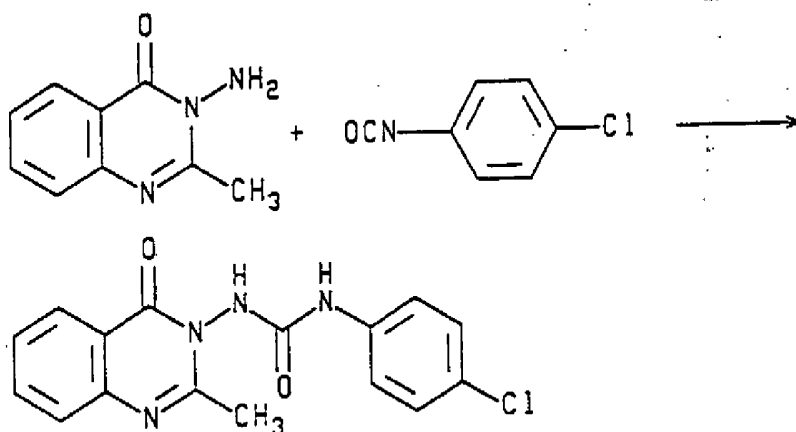
Výroba 1-(p-aminofenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močoviny



5% palladium na uhlíku (0,5 g) se přidá ke směsi 1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)-3-(p-nitrofenyl)močoviny (1,32 g, 4,06 mmol), ethanolu (50 ml) a kyseliny octové (5 ml). Reakční směs se umístí do Parrova hydrogenačního zařízení, kde se 3 hodiny udržuje pod tlakem vodíku 343 kPa. Potom se směs zředí acetonem a přefiltruje. Filtrát se za vakua zkoncentruje a tak se získá hnědý olej. Tento olej se rozpustí v methanolu, roztok se odbarví aktivním uhlím a za vakua zkoncentruje. Získá se titulní produkt ve formě světle hnědé pevné látky (0,9 g) o teplotě tání nad 305 °C.

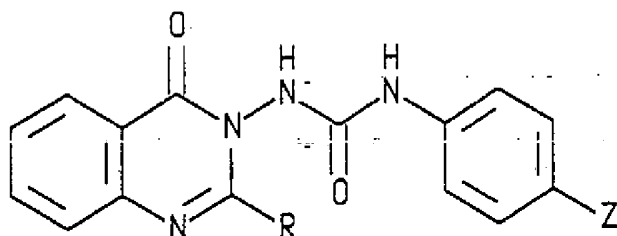
P ř í k l a d 6

Výroba 1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-2-ethylthio-4-oxo-3-chinazoliny)močoviny



Směs 3-amino-2-ethylthio-4-chinazolonu (0,60 g, 2,71 mmol) a 4-chlorofenylisokyanátu (0,48 g, 3,13 mmol) v 1,2-dichlorethanu se 63 hodin vaří pod zpětným chladičem. Potom se směs ochladí na 0 °C a přefiltruje. Filtrační koláč se promyje etherem a vysuší. Získá se titulní sloučenina ve formě bílé pevné látky (0,84 g, 83 %) o teplotě tání 234 až 235 °C.

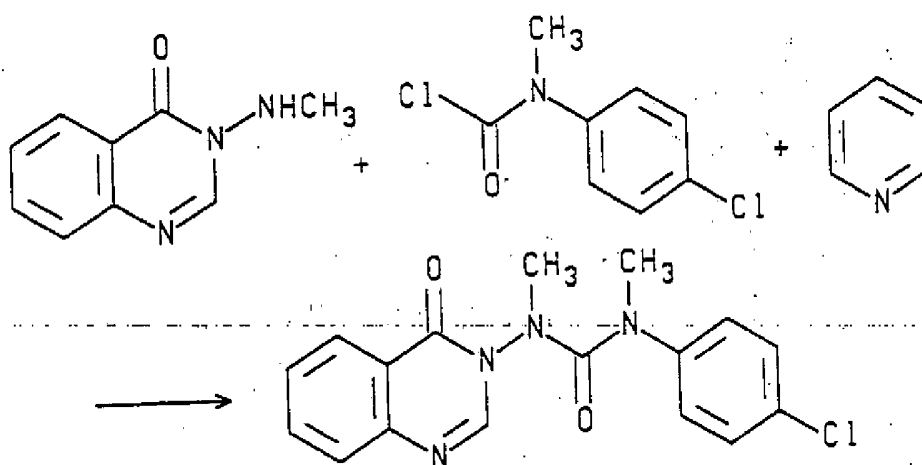
Postupuje se v podstatě výše uvedeným způsobem s tím rozdílem, že se použije vhodně substituovaného 3-amino-4-chinazolonu a vhodně substituovaného isokyanátu. Získají se následující sloučeniny:



R	Z	t.t. °C
OCH ₂ CH ₃	Cl	210 - 212
OCH ₂ CH ₃	Br	221 - 223
SCH ₂ CH ₃	Br	243 - 244
CH ₃	Cl	228 - 229,5

P ř í k l a d 7

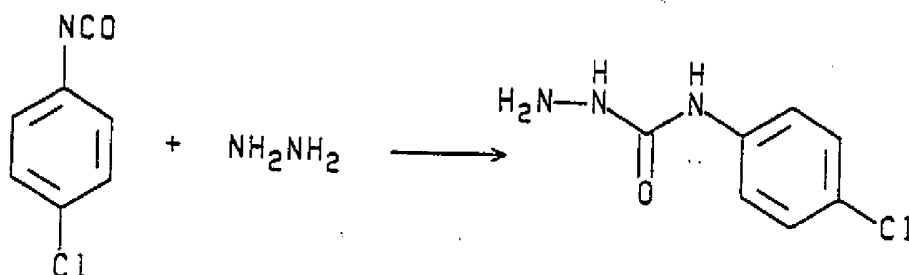
Výroba 1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-1,3-dimethylmočoviny



Přidá se p-chlor-N-methylkarbaniloylchlorid (1,60 g, 7,84 mmol) k roztoku 3-methylamino-4(3H)-chinazolinonu (1,36 g, 7,76 mmol) a pyridinu (630 μ l, 7,79 mmol) v 1,2-dichlor-ethanu. Reakční směs se 2 hodiny vaří pod zpětným chladičem, potom se za vakua zkoncentruje, zředí dichlormethanem a postupně promyje vodou, 5% kyselinou chlorovodíkovou a roztokem chloridu sodného, vysuší síranem hořečnatým a za vakua zkoncentruje. Získá se světle hnědý olej. Chromatografií tohoto oleje na silikagelu za použití 20 až 50 % ethylacetátu v roztoku hexanové směsi se získá titulní sloučenina ve formě bílé pevné látky (0,99 g) o teplotě tání 97 až 120 $^{\circ}$ C.

P ř í k l a d 8

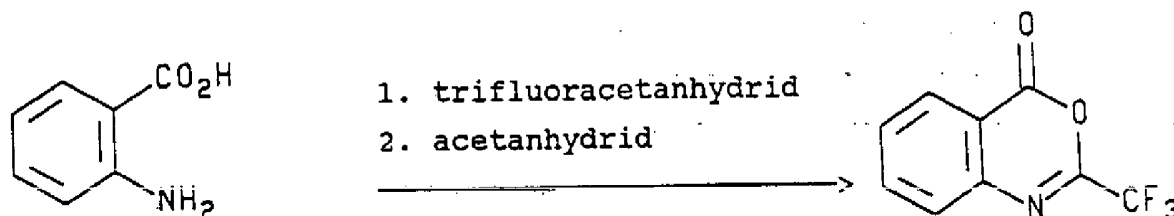
Výroba 4-(p-chlorfenyl)semikarbazidu



Hydrazin (0,83 ml, 26,4 mmol) se přikape k roztoku 4-chlorfenylisokyanátu (3,85 g, 25,1 mmol) v 1,2-dichlor-ethanu. Reakční směs se míchá přes noc při teplotě místnosti a potom se přefiltruje. Filtrační koláč se promyje etherem a vysuší. Získá se titulní sloučenina ve formě bílé pevné látky (4,28 g), která se identifikuje ¹HNMR spektrální analýzou.

P ř í k l a d 9.

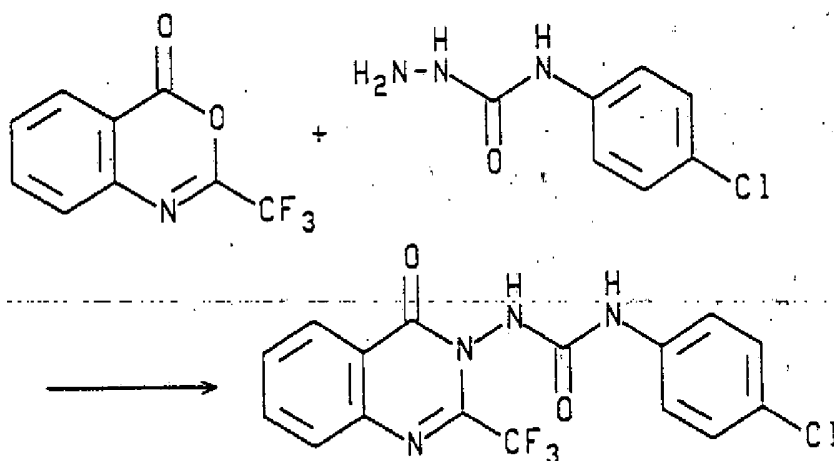
Výroba 2-(trifluormethyl)-4H-3,1-benzoxazin-4-onu



Kyselina anthranilová (10,07 g, 73,43 mmol) se po částech přidá k trifluoracetanhydridu (31 ml). Po dokončení přidavku se reakční směs za vakua zkoncentruje. Získaný zbytek se zředí acetanhydridem, vzniklá směs se 30 minut vaří pod zpětným chladičem, ochladí na teplotu místnosti a těkavé složky se oddestilují. Získá se titulní sloučenina ve formě bílé pevné látky (13,35 g), která se identifikuje $^1\text{HNMR}$ spektrální analýzou.

P ř í k l a d 10

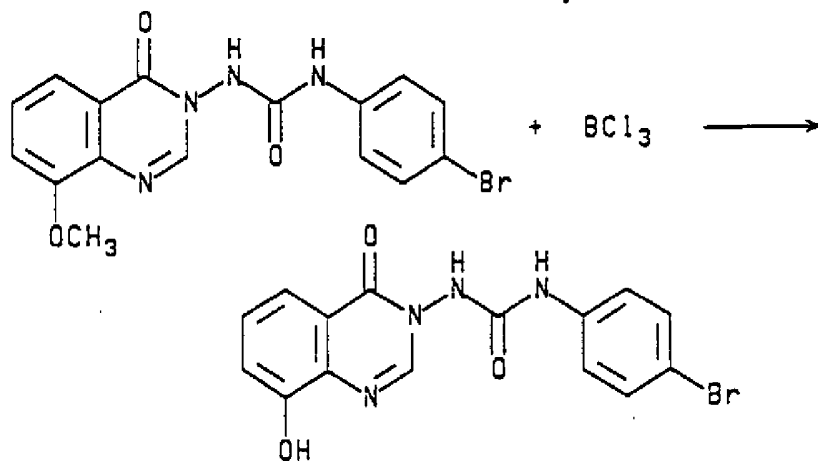
Výroba 1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-2-(trifluoromethyl)-3-chinazolinylnmočoviny



4-(p-chlorfenyl)semikarbazid (1,49 g, 8,03 mmol) se přidá k roztoku 2-(trifluormethyl)-4H-3,1-bezoxazin-4-onu (1,72 g, 8,00 mmol) v pyridinu (27 ml) při 100 °C. Reakční směs se 15 hodin míchá při 100 °C, ochladí na teplotu místnosti a za vakua zkoncentruje. Získá se pevná látka. Tato pevná látka se zředí dichlormethanem a vzniklá směs se postupně promyje 10% kyselinou chlorovodíkovou a vodou a za vakua zkoncentruje na světle hnědou pevnou látku. Tato světle hnědá pevná látka se promyje dichlormethanem a odfiltruje. Filtrát se zkoncentruje za vakua na hnědou pěnu. Tato pěna se zředí etherem a potom se směs postupně promyje 10% kyselinou chlorovodíkovou, vodou a nasyceným roztokem hydrogenuhličitanu sodného. Dále se směs vysuší bezvodým síranem hořečnatým, odbarví aktivním uhlím a za vakua zkoncentruje na smetanově zbarvenou pěnu. Flash chromatografií této smetanově zbarvené pěny na silikagelu za použití směsi dichlormethanu a hexanů v poměru 3:1 se získá titulní sloučenina ve formě bílé pevné látky (0,36 g), která se identifikuje ¹HNMR spektrální analýzou.

P ř í k l a d 1 1

Výroba 1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-hydroxy-4-oxo-3-chinazoliny)močoviny

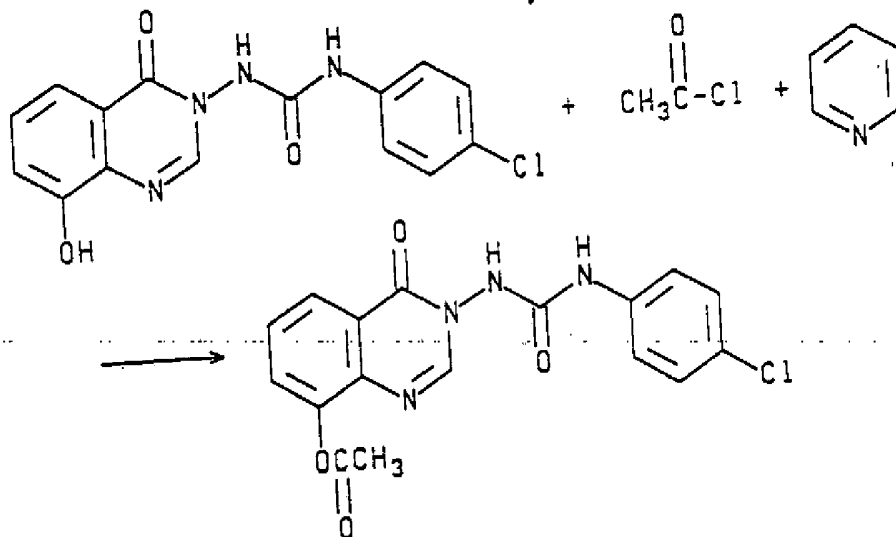


1,0 molární roztok trichloridu boritého v dichlor-methanu (24 ml, 24,0 mmol BCl_3) se přidá ke směsi 1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-methoxy-4-oxo-3-chinazolinyl)-močoviny (3,08 g, 7,91 mmol) v dichlormethanu. Reakční směs se 20 hodin míchá při teplotě místnosti, její pH se nastaví na 8 přidávkem hydrogenuhlčitanu sodného a potom se zkoncentruje za sníženého tlaku na suspenzi. Tato suspenze se přefiltruje a filtrační koláč se promyje vodou a vysuší. Získá se titulní sloučenina ve formě bílé pevné látky (2,55 g), o teplotě tání 276 až 278 °C, která se identifikuje $^1\text{HNMR}$ spektrální analýzou.

Postupuje se v podstatě stejným způsobem jako v tomto příkladu, s tím rozdílem, že se použije 1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-methoxy-4-oxo-3-chinazolinyl)močoviny místo 1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-methoxy-4-oxo-3-chinazolinyl)močoviny. Získá se 1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-hydroxy-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 266 až 268 °C.

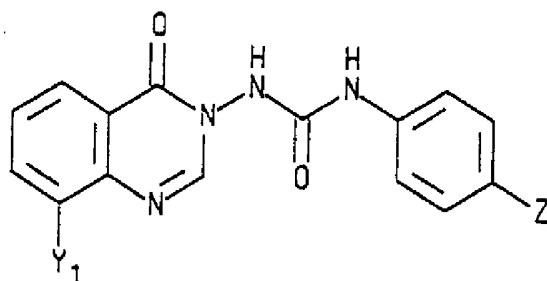
P ř í k l a d 1 2

Výroba acetátu (esteru) 1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-hydroxy-4-oxo-3-chinazolinyl)močoviny



Směs 1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-hydroxy-4-oxo-3-chinazolinyl)močoviny (0,66 g, 2,00 mmol) v dichlormethanu se nechá reagovat s acetylchloridem (0,155 ml, 2,11 mmol) a pyridinem (0,165 ml, 2,04 mmol), vzniklá směs se míchá přes noc a potom se postupně promyje 5% kyselinou chlorovodíkovou, nasyceným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a roztokem chloridu sodného, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a za vakua zkoncentruje na pevnou látku. Tato pevná látka se promyje dichlormethanem a vysuší. Získá se titulní sloučenina ve formě bílé pevné látky (0,30 g) o teplotě tání 216 až 218 °C, která se identifikuje ¹HNMR spektrální analýzou.

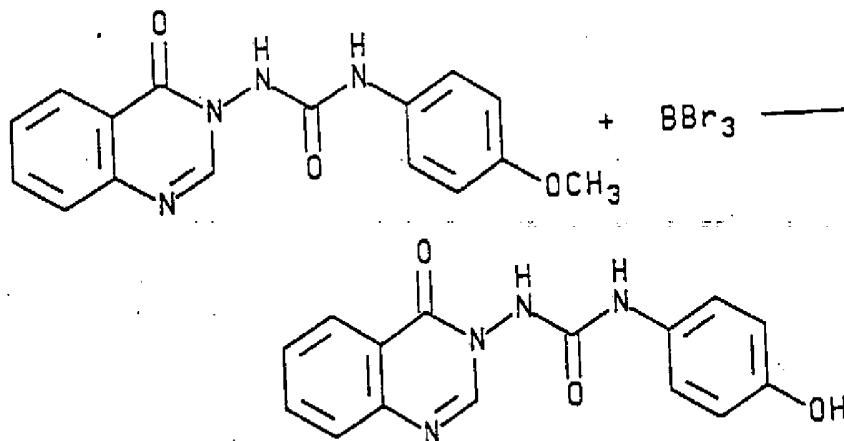
Postupuje se v podstatě stejným způsobem, jako v tomto příkladu, s tím rozdílem, že se použije vhodně substituované 1-(subst.fenyl)-3-(3,4-dihydro-8-hydroxy-4-oxo-3-chinazolinyl)močoviny a vhodného chloridu kyseliny. Získají se následující sloučeniny:



<u>Y₁</u>	<u>Z</u>	<u>t.t. °C</u>
-OC(O)CH ₃	Br	176 - 178
-OC(O)C ₆ H ₅	Br	246 - 247
-OC(O)C ₆ H ₅	Cl	220 - 221

P ř í k l a d 1 3

Výroba 1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)-3-(p-hydroxy-fenyl)močoviny



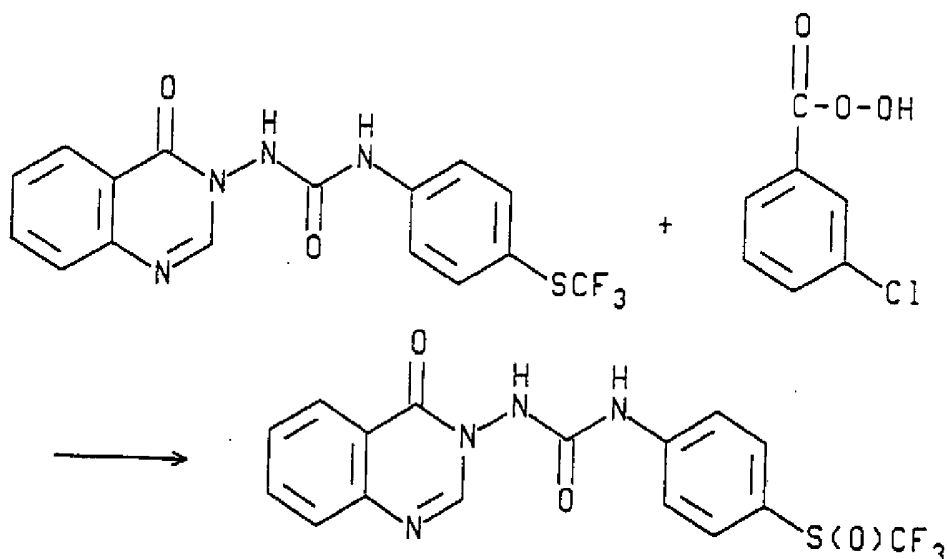
PRIL
VLASTNÍ
PRŮM. ÚSTAV
0 2 7 0
2 7 1 9 3
0 3 0 7 0
2 7 1 9 3

1,0 molární roztok tribromidu boritého (6,45 ml, 6,45 mmol BBr_3) se přikape ke směsi 1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)-3-(p-methoxyfenyl)močoviny (1,0 g, 3,22 mmol) v dichlormethanu pod atmosférou dusíku. Reakční směs se přes noc míchá při teplotě místnosti, její pH se nastaví na asi 8 nasyceným roztokem hydrogenuhličitanu sodného, dále se směs míchá 2 hodiny, promyje vodou a přefiltruje. Filtrační koláč se vysuší, tritruje s horkým acetonem, odfiltruje a vysuší. Získá se titulní sloučenina ve formě bílé pevné látky (výtěžek 0,42 g, teplota tání 220 až 223 °C), která se identifikuje 1H NMR-spektrální analýzou.

P ř í k l a d 1 4

Výroba 1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazoliny)-3-[p-[(trifluor-methyl)sulfinyl]fenyl]močoviny

29878



Směs 1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-[p-((trifluoromethyl)thio)fenyl]močoviny (1,0 g, 2,63 mmol) v chloroformu se ochladí v lázni z ledu a vody a přidá se k ní roztok 3-chlorperoxobenzoové kyseliny (0,57 g, 80 % skutečné sloučeniny, 2,64 mmol) v chloroformu, směs se 3 hodiny míchá při 0 °C, 32 hodin při teplotě místnosti a potom se ochladí na 0 °C. K získané směsi se přidá další 3-chlorperoxobenzoová kyselina (0,114 g, 0,53 mmol) v chloroformu, směs se 36 hodin míchá při teplotě místnosti, zředí dichlormethanem, postupně promyje nasyceným roztokem siřičitanu sodného, nasyceným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a roztokem chloridu sodného, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a za vakua zkoncentruje na žlutou pevnou látku. Chromatografickým této pevné látky na silikagelu za použití směsi ethylacetátu a hexanů v poměru 4:1 se získá titulní sloučenina ve formě bílé pevné látky (0,50 g) o teplotě tání 148 až 150 °C, která se identifikuje ¹HNMR spektrální analýzou.

Postupuje se v podstatě stejným způsobem, přičemž se však použije 3,8 ekvivalentu 3-chlorperoxobenzoové kyseliny. Získá se 1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-[p-((trifluoromethyl)sulfonyl)fenyl]močovina ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 118 až 121 °C.

P ř í k l a d 1 5

Hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti skvrnitosti banánovníku, způsobené *Mycosphaerella fijiensis*

Zkoušené sloučeniny se rozpustí v acetonu a zředí destilovanou vodou obsahující přibližně 0,05 % smáčedla TWEEN 20^(R), což je polyoxyethylensorbitanmonolaurátový surfaktant, vyráběný firmou Atlas Chemical Industries, na koncentraci 200 ppm.

Banánové semenáčky ve stadiu 6 až 7 listů se na vrchní a spodní povrch tří nejmladších nerozvinutých listů postříkají zkoušeným roztokem v takovém množství, až postřik skapává, vysuší a inokulují suspenzí spór *Mycosphaerella fijiensis*. Inokulované banánové semenáčky se přenesou do venku umístěného tunelu z plastu, který je zevnitř obložen mokkými pytli z juty. Teplota se udržuje na 25 až 32 °C a relativní vlhkost v rozmezí od 85 do 100 °C. Po pěti dnech se banánové semenáčky přenesou do částečně zastíněného prostoru ze síťoviny, obloženého vlhkými jutovými pytli a denně se na ně aplikuje vodní mlha. Po optimálním vyvinutí symptomů choroby (28 až 40 dnů po inokulaci) se u banánových semenáčků hodnotí stupeň potlačení choroby podle dále uvedené klasifikační stupnice. Při každé zkoušce se používá inokulovaných ošetřených rostlin, inokulovaných neošetřených rostlin a referenčního standardu.

Klasifikační stupnice

stupeň	stupeň potlačení (%)
0	0
1	1 až 14
2	15 až 29
3	30 až 44
4	45 až 59
5	60 až 74
6	75 až 89
7	90 až 95
8	96 až 99
9	100

Pokud se provádí více než jeden pokus, představují tabelovaná data průměrné hodnoty. Získaná data jsou uvedena v tabulce I.

T a b u l k a I

Hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti
Mycosphaerella fijiensis u banánovníku

sloučenina	stupeň potlačení skvrnitosti způsobené Mycosphaerella fijiensis
(200 ppm)	
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	8,7
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(p-methoxyfenyl)močovina	3,3
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(p-fluorfenyl)močovina	7,7
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- (α,α,α -trifluor-p-tolyl)močovina	8,3
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-fenylmočovina	5,0
1-(3,4-dichlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	4,7
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-(p-tolyl)močovina	6,0
1-(m-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-	

T a b u l k a I - pokračování

Hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti
Mycosphaerella fijiensis u banánovníku

sloučenina	stupeň potlačení skvrnitosti způsobené Mycosphaerella fijiensis
	(200 ppm)
3-chinazolinyl)močovina	1,7
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-(o-fluorfenyl)močovina	5,3
1-(3,5-dichlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo- 3-chinazolinyl)močovina	0,7
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3- (p-fenoxyfenyl)močovina	0,3
1-(4-chlor-3-nitrofenyl)-3-(3,4-dihydro-4- oxo-3-chinazolinyl)močovina	0,0
3-(p-chlorfenyl)-1-(3,4-dihydro-4-oxo-3- chinazolinyl)-1-methylmočovina	4,0
1-(p-aminofenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3- chinazolinyl)močovina	0,3
1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3- chinazolinyl)močovina	8,7

T a b u l k a I - pokračování

Hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti
Mycosphaerella fijiensis u banánovníku

sloučenina	stupeň potlačení skvrnitosti způsobené <i>Mycosphaerella</i> <i>fijiensis</i>
	(200 ppm)
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(<i>m</i> -methoxyfenyl)močovina	0,0
1-(2,4-difluorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	4,3
1-(2,6-difluorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	5,7
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(<i>m</i> -tolyl)močovina	3,0
1-(<i>m</i> -bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	0,0
1-(2,5-difluorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	6,0
1-(<i>p</i> -chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-1,3-dimethylmočovina	1,3
1-(<i>p</i> -chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-2-thiomočovina	8,7

T a b u l k a I - pokračování

Hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti
Mycosphaerella fijiensis u banánovníku

sloučenina	stupeň potlačení skvrnitosti způsobené Mycosphaerella fijiensis (200 ppm)
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-[p-(trifluormethoxy)fenyl]močovina	5,0
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-(α,α,α -trifluor-m-tolyl)močovina	0,3
1-(3-chlor-p-tolyl)-3-(3,4-dihydro-4- oxo-3-chinazolinyl)močovina	1,7
1-(m-acetylfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo- chinazolinyl)močovina	0,0
1-(p-acetylfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo- 3-chinazolinyl)močovina	5,0
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-(p-jodfenyl)močovina	8,0
1-(p-butoxyfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo- 3-chinazolinyl)močovina	4,7
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-(m-ethylfenyl)močovina	1,3

T a b u l k a I - pokračování

Hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti
Mycosphaerella fijiensis u banánovníku

sloučenina	stupeň potlačení skvrnitosti způsobené <i>Mycosphaerella</i> <i>fijiensis</i> (200 ppm)
1-(8-chlor-3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(p-chlorfenyl)močovina	8,7
1-(p-chlorfenyl)-3-(5-fluor-3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	8,0
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(3,4-xylyl)močovina	1,3
1-(4-chlor- α,α,α -trifluor-m-tolyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	0,3
1-(3-chlor-4-fluorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	2,0
1-(4-bifenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	1,7
1-(p-bromfenyl)-3-(5-fluor-3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	8,0
1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-methoxy-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	3,7

T a b u l k a I - pokračování

Hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti
Mycosphaerella fijiensis u banánovníku

sloučenina	stupeň potlačení skvrnitosti způsobené <i>Mycosphaerella</i> <i>fijiensis</i>
(200 ppm)	
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-methoxy-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	1,0
1-(m-kyanofenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	0,3
1-(p-bromfenyl)-3-(8-chlor-3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	8,0
1-(p-kyanofenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	4,7
1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-methyl-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	4,7
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-methyl-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	6,7
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(m-fluorfenyl)močovina	4,0
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(4-fluor-3-nitrofenyl)močovina	0,3

T a b u l k a I - pokračování

Hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti
Mycosphaerella fijiensis u banánovníku

sloučenina	stupeň potlačení skvrnitosti způsobené <i>Mycosphaerella</i> <i>fijiensis</i>
	(200 ppm)
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-2-ethoxy- 4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	6,3
1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-2-ethoxy- 4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	4,7
1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-2-ethylthio- 4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	7,7
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-2-ethyl- thio-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	9,0
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-2-methyl- 4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	5,0

P ř í k l a d 1 6

Hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti cercosporióze
řepy cukrové, způsobené houbou *Cercospora beticola*

Zkoušené sloučeniny se rozpustí v acetonu a zředí
destilovanou vodou obsahující přibližně 0,05 % smáčedla

TWEEN 20^(R), což je polyoxyethylensorbitanmonolaurátový surfaktant, vyráběný firmou Atlas Chemical Industries, na koncentraci 400 ppm.

Dva týdny staré semenáčky řepy se postříkají zkušebním roztokem až do odkapu postřiku, vysuší a inokulují suspenzí konidií *Cercospora beticola*. Inokulované semenáčky řepy se umístí do vlhké komory, v níž se udržuje teplota v rozmezí od 18 do 22 °C a relativní vlhkost 100 %. Po pěti dnech se semenáčky řepy přenesou do skleníku, kde se k nim voda přivádí zespondu (každý den). Když se vyvinou optimální symptomy choroby (10 až 14 dnů po inokulaci), provede se u semenáčků řepy vyhodnocení stupně potlačení choroby za použití klasifikační stupnice uvedené v příkladu 15. Při každé zkoušce se používá inokulovaných ošetřených rostlin, inokulovaných neošetřených rostlin a referenčního standardu. Pokud se provádí více než jeden pokus, představují tabelovaná data průměrné hodnoty. Získaná data jsou uvedena v tabulce II.

T a b u l k a I I

hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti cercosporióze
řepy cukrové

sloučenina	stupeň potlačení cercosporiózy (400 ppm)
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	7,3
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(p-methoxyfenyl)močovina	4,7
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(p-fluorfenyl)močovina	6,7
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(α,α,α -trifluor-p-tolyl)močovina	7,3
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-fenylmočovina	6,0
1-(3,4-dichlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	4,3
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(p-tolyl)močovina	7,3
1-(m-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	5,3

T a b u l k a I I - pokračování

hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti cercosporióze
řepy cukrové

sloučenina	stupeň potlačení cercosporiózy (400 ppm)
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-(o-fluorfenyl)močovina	6,7
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-(p-nitrofenyl)močovina	4,7
1-(3,5-dichlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo- 3-chinazolinyl)močovina	2,3
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3- (p-fenoxyfenyl)močovina	5,7
1-(4-chlor-3-nitrofenyl)-3-(3,4-dihydro-4- oxo-3-chinazolinyl)močovina	2,0
3-(p-chlorfenyl)-1-(3,4-dihydro-4-oxo-3- chinazolinyl)-1-methylmočovina	0,3
1-(p-aminofenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3- chinazolinyl)močovina	3,3
1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3- chinazolinyl)močovina	7,7

T a b u l k a I I - pokračování

hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti cercosporióze
řepy cukrové

sloučenina	stupeň potlačení cercosporiózy (400 ppm)
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(m-methoxyfenyl)močovina	2,3
1-(2,4-difluorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	3,3
1-(2,6-difluorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	6,0
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(m-tolyl)močovina	2,3
1-(m-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	2,7
1-(2,5-difluorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	7,0
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-1,3-dimethylmočovina	5,3
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-2-thiomočovina	6,7

T a b u l k a I I - pokračování

hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti cercosporióze
řepy cukrové

sloučenina	stupeň potlačení cercosporiózy (400 ppm)
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-[p-(trifluormethoxy)fenyl]močovina	1,3
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-(α,α,α -trifluor-m-tolyl)močovina	3,3
1-(3-chlor-p-tolyl)-3-(3,4-dihydro-4- oxo-3-chinazolinyl)močovina	0,0
1-(m-acetylphenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo- chinazolinyl)močovina	1,6
1-(p-acetylphenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo- 3-chinazolinyl)močovina	0,6
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-(p-jodfenyl)močovina	0,6
1-(p-butoxyfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo- 3-chinazolinyl)močovina	0,0
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-(m-ethylphenyl)močovina	0,0

T a b u l k a I I - pokračování

hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti cercosporióze
řepy cukrové

sloučenina	stupeň potlačení cercosporiózy (400 ppm)
1-(8-chlor-3,4-dihydro-4-oxo-3- chinazolinyl)-3-(p-chlorfenyl)močovina	2,0
1-(p-chlorfenyl)-3-(5-fluor-3,4- dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	7,7
1-(4-chlor- α,α,α -trifluor-m-tolyl)-3- (3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	1,0
1-(3-chlor-4-fluorfenyl)-3-(3,4-dihydro- 4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	1,0
1-(4-bifenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3- chinazolinyl)močovina	0,0
1-(p-bromfenyl)-3-(5-fluor-3,4-dihydro- 4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	8,6
1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-methoxy- 4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	0,0
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-methoxy- 4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	0,0

T a b u l k a I I - pokračování

hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti cercosporióze
řepy cukrové

sloučenina	stupeň potlačení cercosporiózy (400 ppm)
1-(m-kyanofenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3- chinazolinyl)močovina	0,7
1-(p-bromfenyl)-3-(8-chlor-3,4-dihydro- 4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	4,0
1-(p-kyanofenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo- 3-chinazolinyl)močovina	4,7
1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-methyl- 4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	1,0
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-8-methyl- 4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	6,0
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)- 3-(p-isopropylfenyl)močovina	2,7
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3- (m-fluorfenyl)močovina	5,0
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3- (3,4-xylyl)močovina	1,0

T a b u l k a I I - pokračování

hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti cercosporióze řepy cukrové

sloučenina	stupeň potlačení cercosporiózy (400 ppm)
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(4-fluor-3-nitrofenyl)močovina	3,3
1-(p-bromfenyl)-3-(6-fluor-3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	5,0
1-(p-bromfenyl)-3-(7-fluor-3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	0,0
1-(p-chlorfenyl)-3-(7-fluor-3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	1,3
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-2-ethoxy-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	1,0
1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-2-ethoxy-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	0,7
1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-2-ethylthio-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	0,0
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-2-ethylthio-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	0,7

T a b u l k a I I - pokračování

hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti cercosporióze řepy cukrové

sloučenina	stupeň potlačení cercosporiózy (400 ppm)
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-2-methyl-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	7,3

P ř í k l a d 1 7

Hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti skvrnitosti podzemnice olejné, způsobené *Cercosporidium personatum*

Zkoušené sloučeniny se zpracují na roztokové prostředky o koncentraci 200 a 100 ppm, obsahující aceton s přísadou činidla Triton X-155^(R) (oktylfenoxypolyethoxyethanolový dispergátor, výrobek firmy Rohm and Haas Co.) a vodu (5%/0,1%, objemově).

Tímto roztokem se postříkají rostliny podzemnice olejné, postřik se nechá zaschnout a potom se rostliny inokulují konidii *Cercosporidium personatum*. Po optimálním vývinu symptomů choroby se u rostlin vypočítá procentický stupeň potlačení choroby za použití následujícího vzorce:

$$\text{potlačení (\%)} = \frac{\text{počet lézí u kontrolních rostlin} - \text{počet lézí u ošetřených rostlin}}{\text{počet lézí u kontrolních rostlin}} \times 100$$

Při každé zkoušce se používá inokulovaných ošetřených rostlin, inokulovaných neošetřených rostlin a referenčního standardu. Pokud se provádí více než jeden pokus, představují tabelovaná data průměrné hodnoty. Získaná data jsou uvedena v tabulce III.

T a b u l k a I I I

Hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti skvrnitosti způsobené *Cercosporidium personatum* u podzemnice olejné

sloučenina	koncentrace (ppm)	procentické potlačení skvrnitosti způsobené <i>Cercosporidium personatum</i>
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	200	100
	100	99
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-2-thiomočovina	200	100
	100	100
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(p-fluorfenyl)močovina	200	95
	100	86

T a b u l k a I I I - pokračování

Hodnocení účinnosti zkoušený sloučenin proti skvrnitosti způsobené *Cercosporidium personatum* u podzemnice olejné

sloučenina	koncentrace (ppm)	procentické potlačení skvrni- tosti způsobené <i>Cercosporidium</i> <i>personatum</i>
1-(p-chlorfenyl)-3-(5-fluoro-3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	200 100	79 85
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(p-fluorfenyl)-2-thiomočovina	200 100	81 90
1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(α,α,α -trifluor-p-tolyl)močovina	200 100	98 93
1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovina	200 100	100 93
1-(8-chlor-3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(p-chlorfenyl)močovina	200 100	96 89

T a b u l k a I I I - pokračování

Hodnocení účinnosti zkoušených sloučenin proti skvrnitosti způsobené *Cercosporidium personatum* u podzemnice olejné

sloučenina	koncentrace (ppm)	procentické potlačení skvrni- tosti způsobené <i>Cercosporidium</i> <i>personatum</i>
1-(p-bromfenyl)-3-(5-fluor- 3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazo- linyl)močovina	200 100	94 81
1-(p-bromfenyl)-3-(3,4- dihydro-4-oxo-3-chinazoli- nyl)-2-thiomočovina	200 100	99 90

P ř í k l a d 1 8

Hodnocení systemického účinku zkoušených sloučenin v půdě proti cercosporióze řepy cukrové, způsobené houbou *Cercospora beticola*

Zkušební roztoky se vyrobí rozpuštěním zkoušených sloučenin v acetonu a zředěním vzniklých roztoků deionizovanou vodou s obsahem asi 0,05 % TWEEN 20^(R) (polyoxyethylensorbitanmonolaurátová povrchově aktivní látka, vyráběná firmou Atlas Chemical Industries).

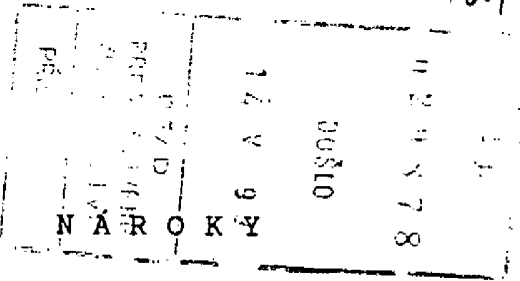
Zkušební roztok se aplikuje na povrch půdy v kořenáčích, obsahujících 5 týdnů staré semenáčky řepy cukrové. Aplikace na kořenáče se provádí v množství, které je ekvivalentní stupni ošetření přibližně 2,5 až 10,0 kg účinné sloučeniny na hektar. Po třech dnech se semenáčky řepy inokulují suspenzí konidií *Cercospora beticola*. Inokulované semenáčky řepy se umístí do vlhké komory na dobu 5 dnů. Potom se semenáčky řepy přenesou do skleníku, kde se k nim voda přivádí zespodu (každý den). Když se vyvinou optimální symptomy choroby (10 až 14 dnů po inokulaci), provede se u semenáčků řepy vyhodnocení stupně potlačení choroby za použití klasifikační stupnice uvedené v příkladu 15. Při každé zkoušce se používá inokulovaných ošetřených rostlin, inokulovaných neošetřených rostlin a referenčního standardu.

Pokud se provádí více než jeden pokus, představují tabelovaná data průměrné hodnoty. Získaná data jsou uvedena v tabulce IV.

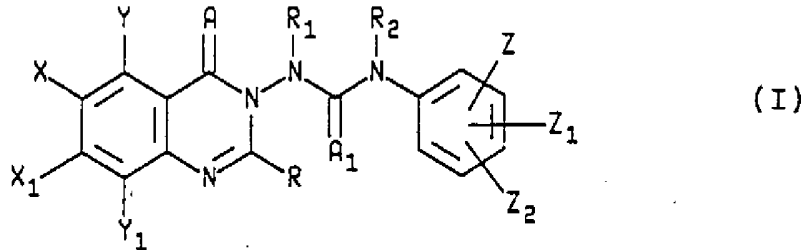
T a b u l k a I V

Hodnocení systemického účinku zkoušených sloučenin v půdě
proti cercosporióze řepy cukrové

sloučenina	stupeň ošetření (kg/ha)	potlačení cercosporiózy řepy cukrové
1-(p-chlorfenyl)-3- (3,4-dihydro-4-oxo-3- chinazolinyl)močovina	10,0 5,0 2,5	8,7 8,0 9,0
1-(p-chlorfenyl)-3- (3,4-dihydro-4-oxo-3- chinazolinyl)-2-thio- močovina	10,0 5,0	5,7 7,3
1-(p-chlorfenyl)-3- (5-fluor-3,4-dihydro- 4-oxo-3-chinazolinyl)- močovina	10,0 5,0	7,0 4,7
1-(3,4-dihydro-4-oxo- 3-chinazolinyl)-3- (α,α,α -trifluor-p- tolyl)močovina	10,0 5,0	5,0 6,0
1-(p-bromfenyl)-3- (3,4-dihydro-4-oxo-3- chinazolinyl)močovina	10,0 5,0	5,3 6,3
1-(8-chlor-3,4-dihydro- 4-oxo-3-chinazolinyl)-3- (p-chlorfenyl)močovina	10,0 5,0	2,3 2,0



1. 1-aryl-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)močovinné sloučeniny obecného vzorce I



kde

X a X₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku nebo atom fluoru;

Y a Y₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo fenylyskupinami, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, alkoxykarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylovém zbytku, alkykarbonyloxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku nebo fenylykarbonyloxyskupinu;

R představuje atom vodíku nebo skupinu obecného vzorce A₂R₃, kde A₂ a R₃ mají dále uvedený význam;

R₃ představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo fenylyskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkylskupinami s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxy skupinami s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_1 a R_2 , nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu;

A , A_1 a A_2 nezávisle představuje vždy atom kyslíku nebo atom síry;

Z , Z_1 a Z_2 nezávisle představuje vždy atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxykupinu, skupinu obecného vzorce $R_4S(O)_n$, kde R_4 a n mají dále uvedený význam, fenylyskupinu, fenoxyskupinu nebo alkylkarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku; za předpokladu, že v polohách 2 a 6 fenylového kruhu mohou být přítomny pouze atomy vodíku nebo fluoru;

R_4 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu; a

n představuje celé číslo 0, 1 nebo 2,

přičemž když X , X_1 , Y , Y_1 , R , R_1 a R_2 představuje atom vodíku, A představuje atom kyslíku a A_1 představuje atom síry, potom alespoň jeden ze symbolů Z , Z_1 nebo Z_2 představuje jiný substituent než atom vodíku.

2. Sloučeniny podle nároku 1, v nichž

X a X_1 představuje atom vodíku;

Y a Y_1 , nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku, atom halogenu;

R představuje atom vodíku nebo skupinu obecného vzorce A_2R_3 , kde A_2 a R_3 mají dále uvedený význam;

R_3 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_1 a R_2 představuje atom vodíku;

A představuje atom kyslíku;

A_1 a A_2 nezávisle představuje vždy atom kyslíku nebo atom síry;

Z představuje atom vodíku; a

Z_1 a Z_2 nezávisle představuje vždy atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu.

3. Sloučeniny, podle nároku 2, zvolené ze souboru zahrnujícího

1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-močovinu;

1-(p-bromfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-močovinu;

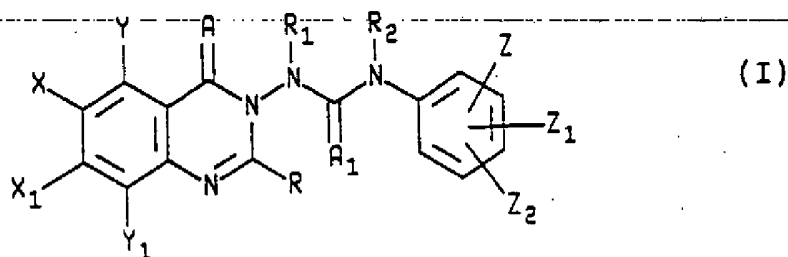
1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-2-thiomočovinu;

1-(8-chlor-3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(p-chlor-fenyl)močovinu;

1-(3,4-dihydro-4-oxo-3-chinazolinyl)-3-(α,α,α -trifluor-p-tolyl)močovinu a

1-(p-chlorfenyl)-3-(3,4-dihydro-2-ethylthio-4-oxo-3-chinazolinyl)močovinu.

4. Způsob prevence choroby, potlačování choroby nebo zlepšování zdravotního stavu v případě chorob způsobených fytopatogenními houbami, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se houba uvádí do styku s fungicidně účinným množstvím sloučeniny obecného vzorce I -



kde

X a X₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku nebo atom fluoru;

Y a Y₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo fenylskupinami, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, alkoxykarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylovém zbytku, alkykarbonyloxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku nebo

- R představuje atom vodíku, skupinu obecného vzorce A_2R_3 , kde A_2 a R_3 mají dále uvedený význam nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu;
- R_3 představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkylskupinami s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxy- skupinami s 1 až 4 atomy uhlíku;
- R_1 a R_2 , nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu;
- A , A_1 a A_2 nezávisle představuje vždy atom kyslíku nebo atom síry;
- Z , Z_1 a Z_2 nezávisle představuje vždy atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkoxy- skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, nitro- skupinu, kyanoskupinu, hydroxy- skupinu, skupinu obecného vzorce $R_4S(O)_n$, kde R_4 a n mají dále uvedený význam, fenylskupinu, fenoxyskupinu nebo alkylkarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku; za předpokladu, že v polohách 2 a 6 fenylového kruhu mohou být přítomny pouze atomy vodíku nebo fluoru;
- R_4 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více

atomy halogenu; a

n představuje celé číslo 0, 1 nebo 2.

5. Způsob podle nároku 4, v y z n a č u j í c í s e t í m, že choroba je zvolena ze souboru zahrnujícího skvrnitost banánovníku způsobenou houbou *Mycosphaerella fijiensis*, cercosporiózu řepy cukrové a skvrnitost podzemnice olejné způsobenou houbou *Cercosporidium personatum*.

6. Způsob podle nároku 4, v y z n a č u j í c í s e t í m, že houba je zvolena ze souboru zahrnujícího *Mycosphaerella fijiensis*, *Cercospora beticola* a *Cercosporidium personatum*.

7. Způsob podle nároku 4, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se použije sloučenin obecného vzorce I, v nichž

X a X₁ představuje atom vodíku;

Y a Y₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku, atom halogenu;

R představuje atom vodíku nebo skupinu obecného vzorce A₂R₃, kde A₂ a R₃ mají dále uvedený význam;

R₃ představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R₁ a R₂ představuje atom vodíku;

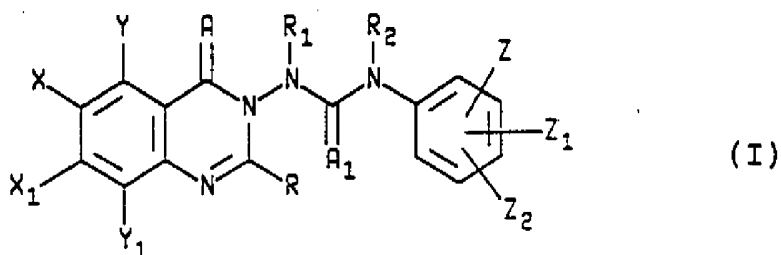
A představuje atom kyslíku;

A₁ a A₂ nezávisle představuje vždy atom kyslíku nebo atom síry;

Z představuje atom vodíku; a

Z₁ a Z₂ nezávisle představuje vždy atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu.

8. Způsob ochrany rostlin, semen rostlin nebo hlíz před houbovým zamořením a houbovou chorobou, v y z n a č u j í - c í s e t í m, že se na rostliny, semena rostlin nebo hlízy nebo na půdu nebo vodu, v níž se rostliny pěstují, aplikuje fungicidně účinné množství sloučeniny obecného vzorce I



kde

X a X₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku nebo atom fluoru;

Y a Y₁, nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo fenylskupinami, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, alkoxykarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylovém zbytku, alkykarbonyloxyskupinu s 1 až

4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku nebo fenyلكarboxyloxykupinu;

R představuje atom vodíku, skupinu obecného vzorce A_2R_3 , kde A_2 a R_3 mají dále uvedený význam nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu;

R_3 představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo fenyلكupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkylskupinami s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxykupinami s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_1 a R_2 , nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu;

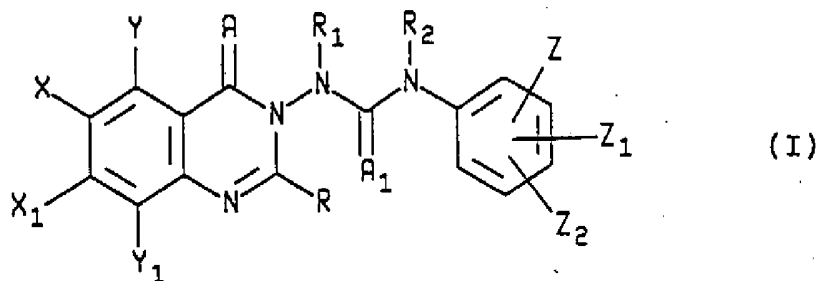
A, A_1 a A_2 nezávisle představuje vždy atom kyslíku nebo atom síry;

Z, Z_1 a Z_2 nezávisle představuje vždy atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxykupinu, skupinu obecného vzorce $R_4S(O)_n$, kde R_4 a n mají dále uvedený význam, fenyلكupinu, fenoxyskupinu nebo alkylkarboxyloxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku; za předpokladu, že v polohách 2 a 6 fenylového kruhu mohou být přítomny pouze atomy vodíku nebo fluoru;

R_4 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu; a

n představuje celé číslo 0, 1 nebo 2.

9. Prostředek pro potlačování fytopatogenních hub, v y - z n a č u j í c í s e t í m, že obsahuje inertní kapalné nebo pevné ředidlo a fungicidně účinné množství sloučeniny obecného vzorce I



kde

X a X_1 , nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku nebo atom fluoru;

Y a Y_1 , nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo fenylyskupinami, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, alkoxykarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylovém zbytku, alkykarbonyloxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku nebo fenylykarbonyloxyskupinu;

R představuje atom vodíku, skupinu obecného vzorce A_2R_3 , kde A_2 a R_3 mají dále uvedený význam nebo

alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu;

R_3 představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkylskupinami s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxy-skupinami s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_1 a R_2 , nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu;

A , A_1 a A_2 nezávisle představuje vždy atom kyslíku nebo atom síry;

Z , Z_1 a Z_2 nezávisle představuje vždy atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxy-skupinu, skupinu obecného vzorce $R_4S(O)_n$, kde R_4 a n mají dále uvedený význam, fenylskupinu, fenoxyskupinu nebo alkylkarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku; za předpokladu, že v polohách 2 a 6 fenylvého kruhu mohou být přítomny pouze atomy vodíku nebo fluoru;

R_4 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu; a

n představuje celé číslo 0, 1 nebo 2.

10. Prostředek podle nároku 9, v y z n a č u j í c í s e t í m, že jako sloučeninu obecného vzorce I obsahuje sloučeninu, v níž

X a X_1 představuje atom vodíku;

Y a Y_1 , nezávisle jeden na druhém, představuje atom vodíku, atom halogenu;

R představuje atom vodíku nebo skupinu obecného vzorce A_2R_3 , kde A_2 a R_3 mají dále uvedený význam;

R_3 představuje, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_1 a R_2 představuje atom vodíku;

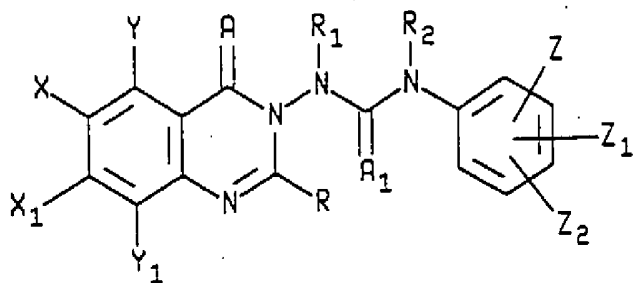
A představuje atom kyslíku;

A_1 a A_2 nezávisle představuje vždy atom kyslíku nebo atom síry;

Z představuje atom vodíku; a

Z_1 a Z_2 nezávisle představuje vždy atom vodíku, atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu

Vzorec pro anotaci (I)



(I)

PRIL	URAD	14. V 93	11 2 9 5 7 8	8. J.
	PROJEKT JEHO		POŠLO	
	VLASNIK CTVR			