

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

204043
(11) (B2)



GRAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

(22) Přihlášeno 04 01 79
(21) (PV 134-79)
(32) (31) (33) Právo přednosti od 07 01 78
(P 28 00 544.9)
Německá spolková republika
(40) Zveřejněno 30 06 80
(45) Vydáno 15 12 83

(51) Int. Cl.³
A 01 N 43/82

(72)
Autor vynálezu

BÜCHEL KARL HEINZ prof. dr., KRÄMER WOLFGANG dr.,
WUPPERTAL a BRANDES WILHELM dr., LEICHLINGEN (NSR)

(73)
Majitel patentu

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, LEVERKUSEN (NSR)

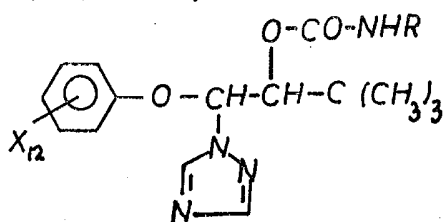
(54) Fungicidní prostředek a způsob výroby účinných látek

1

Vynález se týká fungicidních prostředků, které obsahují jako účinnou složku nové karbamoyltriazolyl-O,N-acetaly. Dále se vynález týká způsobu výroby těchto nových fungicidně účinných látek.

Je již známo, že acylované triazolyl-O,N-acetaly, jako zejména ve fenylové části substituované 2-alkylkarbonyloxy-3,3-dimethyl-1-fenoxy-1-(1,2,4-triazol-1-yl)butany, mají dobré fungicidní vlastnosti (srov. DOS 2 600 799). Jejich účinek však není, zejména při nižších aplikovaných množstvích a koncentracích, vždy zcela uspokojivý. Dále je již obecně delší dobu známo, že ethylen-1,2-bis-dithiokarbamat zinečnatý je dobrým prostředkem k potírání houbových chorob rostlin [srov. Phytopathology 33, 1113 (1963)]. Jeho použití je však možné pouze v omezeném měřítku, protože při nízkých aplikovaných množstvích a koncentracích je dílem méně účinný.

Nyní bylo zjištěno, že nové karbamoyltriazolyl-O,N-acetaly obecného vzorce I,



(1)

2

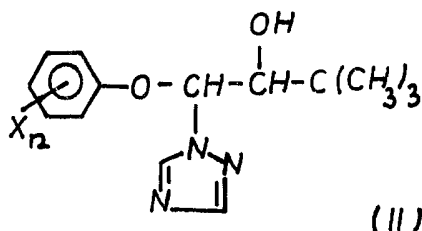
v němž znamená

R alkylovou skupinu s 5 až 12 atomy uhlíku, halogen alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a s 1 až 5 stejnými nebo rozdílnými atomy halogenu, zejména atomy fluoru a chloru, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové i alkoxylové části, fenylovou skupinu, která je substituována jednou nebo vícekrát přímo nebo rozvětvenou alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinou s 1 až 2 atomy uhlíku, jakož i alkoxykarbonylalkenylou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části a s 2 až 4 atomy uhlíku v alkenylové části, přičemž uvedené substituenty mohou být stejné nebo vzájemně rozdílné, a dále znamená alkylsulfonylalkenylkarbamoylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části a s 2 až 4 atomy uhlíku v alkenylové části,

X halogen nebo fenylovou skupinu a n celá čísla od 0 do 5, jakož i jejich fyziologicky použitelné adiční soli s kyselinami a komplexní sloučeniny se solemi kovů, mají silné fungicidní vlastnosti.

Sloučeniny obecného vzorce I mají dva asymetrické atomy uhlíku a mohou být proto přítomny v erythro-, jakož i v threo-formě. V obou případech se vyskytují převážně jako racemáty.

Podle vynálezu se nové karbamoyltriazolyl-O,N-acetaly obecného vzorce I vyrábějí tím, že se triazolylové deriváty obecného vzorce II,



v němž

X a n mají význam uvedený pod vzorcem I, uvádějí v reakci s isokyanáty obecného vzorce III,



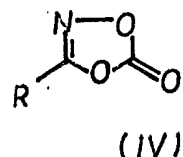
v němž

R má význam uvedený pod vzorcem I, v přítomnosti rozpouštědla a popřípadě v přítomnosti katalyzátoru, načež se získané sloučeniny popřípadě převedou adicí kyselin nebo solí kovů na příslušné soli, popřípadě na komplexní kovové sloučeniny.

Postup podle vynálezu bude v dalším textu označován také jako postup a).

Sloučeniny obecného vzorce I, jejich fyziologicky použitelné adiční soli s kyselinou nebo komplexní sloučeniny se solemi kovů se mohou dále vyrábět tím, že se triazolylové deriváty obecného vzorce II uvá-

dějí v reakci se substituovanými 1,3,4-dioxazol-2-ony obecného vzorce IV,

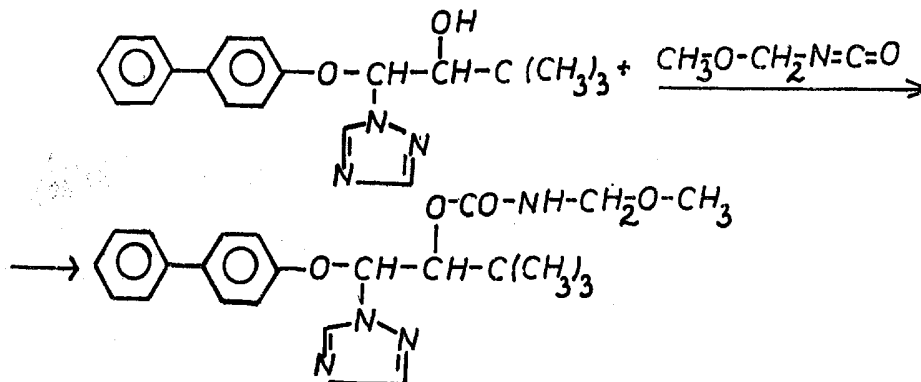


v němž

R má shora uvedený význam, v přítomnosti rozpouštědla a popřípadě v přítomnosti katalyzátoru, načež se získané karbamoyltriazolyl-O,N-acetaly popřípadě převedou reakcí s kyselinami na soli, nebo reakcí se solemi kovů na odpovídající komplexní sloučeniny s kovy. Tento postup bude v dalším textu označován jako postup b).

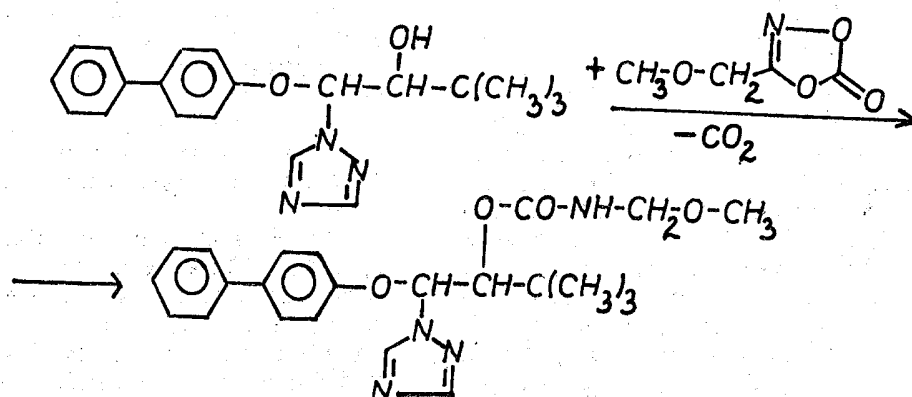
S překvapením vykazují karbamoyl-O,N-acetaly podle vynálezu značně vyšší fungicidní účinnost než acylované triazoly-O,N-acetaly, známé ze stavu techniky, jako zejména ve fenylové části substituované 2-alkylkarbonyloxy-3,3-dimethyl-1-fenoxy-1-(1,2,4-triazolyl)butany, které jsou po chemické stránce a co do účinku nejbližší příbuznými sloučeninami, a než ethylen-1,2-bis-dithiokarbamat zinečnatý, který je známou látkou se stejným druhem účinku.

Použije-li se jako výchozích látek 1-(4-bifenyloxy)-3,3-dimethyl-1-(1,2,4-triazolyl)butan-2-olu a methoxymethylisokyanátu, pak lze průběh reakce postupem podle vynálezu (postup a) znázornit následujícím reakčním schématem:



Použije-li se jako výchozí látky 1-(4-bifenyloxy)-3,3-dimethyl-1-(1,2,4-triazolyl)butan-2-olu a 5-methoxymethyl-1,3,4-

-dioxal-2-onu, pak lze průběh reakce podle postupu b) znázornit následujícím reakčním schématem:



Triazolylové deriváty používané jako výchozí látky jsou obecně definovány vzorcem II. V tomto vzorci znamená symbol X halogen nebo fenylovou skupinu a index n znamená celá čísla od 0 do 5, výhodně pak znamená celá čísla od 0 do 3.

Výchozí látky vzorce II jsou známy (srov. DOS 2 324 010). Dosud neznámé výchozí látky vzorce II se mohou získat podle již popsaných postupů tím, že se například odpovídající deriváty ketonu redukuje isopropoxidem hlinitým nebo komplexními hydridy v přítomnosti rozpouštědla.

Isokyanáty, které se používají jako výchozí látky pro postup podle vynálezu (postup a), jsou obecně definovány vzorcem III. V tomto vzorci znamená symbol R výhodně přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu s 5 až 12 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu až se 4 atomy uhlíku a až s 5 stejnými nebo rozdílnými atomy halogenu, jako zejména atomy fluoru a chloru, jakož i alkoxyalkylovou skupinu vždy s 1 až 4 atomy uhlíku v každé z alkylových částí. Symbol R znamená kromě toho výhodně jednou nebo několikrát substituovanou fenylovou skupinu, přičemž jako substituenty přicházejí v úvahu výhodně: přímá nebo rozvětvená alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupina s 1 nebo 2 atomy uhlíku, jakož i alkoxykarbonylalkenylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části a s 2 až 4 atomy uhlíku v alkenylové části. Symbol R dále znamená výhodně alkylsulfonfylalkenylkarbamoylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části a s 2 až 4 atomy uhlíku v alkenylové části.

Isokyanáty vzorce III jsou známy nebo se dají vyrábět podle obecně obvyklých a známých postupů. Tak se mohou vyrobit například reakcí aminů s fosgenem a následujícím zahříváním.

1,3,4-dioxazol-2-ony, používané jako výchozí látky pro postup b), jsou obecně definovány vzorcem IV. V tomto vzorci znamená symbol R výhodně ty zbytky, které již byly jako výhodné uvedeny u isokyanátů vzorce III.

1,3,4-dioxazol-2-ony vzorce IV jsou známy (srov. G. Beck, Chem. Ber. 84, 688 [1951])

nebo se dají vyrábět podle obecně obvyklých a známých postupů. Tak se dají vyrobit například reakcí příslušných hydroxykarboxylových kyselin nebo hydrazidů kyselin s fosgenem za zahřívání na teplotu varu.

Jako rozpouštědla přicházejí pro reakci postupem podle vynálezu (postup a) v úvahu výhodně všechna inertní organická rozpouštědla. K těm patří výhodně ketony, jako diethylketon, zejména aceton a methyl-ethylketon; nitrily, jako propionitril, zejména acetonitril; ethery, jako tetrahydrofuran nebo dioxan; estery, jako ethylacetát; aromatické uhlovodíky, jako benzen nebo toluen, a halogenované uhlovodíky, jako methylenchlorid, tetrachlormethan nebo chloroform.

Jako katalyzátory se mohou při postupu podle vynálezu (postup a) používat: terciární báze, jako triethylamin a pyridin, nebo organické sloučeniny cínu, jako dibutylcindilaurát.

Reakční teploty se mohou při provádění postupu podle vynálezu (postup a) měnit v širokém rozmezí. Obecně se pracuje při teplotách 0 až 100 °C, výhodně mezi 20 a 70 °C.

Při provádění postupu podle varianty a) se pracuje výhodně za použití molárních množství. K izolaci sloučenin vzorce I se rozpouštědlo oddestiluje a zbytek se zpracuje za použití obvyklých metod.

Jako rozpouštědla přicházejí pro reakci podle varianty postupu b) v úvahu výhodně inertní organická rozpouštědla. K těm patří výhodně rozpouštědla, která byla již uvedena pro variantu postupu a).

Jako katalyzátory se mohou při postupu podle varianty b) používat výhodně terciární aminy, jako například triethylamin, nebo soli mastných kyselin s alkalickými kovy, jako například octan sodný.

Reakční teploty se mohou při provádění postupu varianty b) měnit v širokém rozmezí. Obecně se pracuje při teplotách 60 až 150 °C, výhodně 80 až 100 °C.

Při provádění postupu podle varianty b) se pracuje výhodně v molárních množstvích. K izolaci sloučenin vzorce I se rozpouště-

dlo oddestiluje a zbytek se zpracuje obvyklými metodami.

Pro výrobu adičních solí sloučenin vzorce I s kyselinami přicházejí v úvahu všechny fyziologicky použitelné kyseliny. K těm patří výhodně halogenovodíkové kyseliny, jako například chlorovodíková a bromovodíková kyselina, zejména chlorovodíková kyselina, dále kyselina fosforečná, dusičná, sírová, jednosytné a dvojsytné karboxylové kyseliny a hydroxykarboxylové kyseliny, jako například kyselina octová, maleinová, jantarová, fumarová, vinná, citrónová, salicylová, sorbová, mléčná, jakož i sulfonové kyseliny, jako například kyselina p-toluen-sulfonová a 1,5-disulfonová.

Soli sloučenin vzorce I se mohou získávat jednoduchým způsobem obvyklými metodami pro přípravu solí, například rozpouštěním sloučeniny vzorce I ve vhodném inertním rozpouštědle a přidáním kyseliny, například kyseliny chlorovodíkové, a známým způsobem se izolují, například odfiltrováním, a popřípadě se čistí promýváním inertním organickým rozpouštědlem.

Pro přípravu komplexních solí s kovy odvozených od sloučenin vzorce I přicházejí v úvahu soli kovů II. až IV. hlavní skupiny a I. a II., jakož i IV. až VIII. vedlejší skupiny periodického systému, přičemž jako příklady lze uvést měď, zinek, mangan, hořčík, cín, železo a nikl. Jako anionty solí přicházejí v úvahu a anionty, které se odvozují od fyziologicky použitelných kyselin. K těm náleží výhodně halogenovodíkové kyseliny, jako například chlorovodíková a bromovodíková kyselina, dále kyselina fosforečná, dusičná a sírová.

Komplexy sloučenin vzorce I s kovy se mohou získat jednoduchým způsobem, například rozpouštěním soli kovu v alkoholu, například v methanolu, a přidáním tohoto roztoku ke sloučenině vzorce I. Komplexní sloučeniny s kovy lze izolovat známým způsobem, například filtrací, a popřípadě se čistí překrystalováním.

Jako zvlášť účinné zástupce účinných látek podle vynálezu lze kromě sloučenin uvedených v příkladech provedení a v tabulce I uvést například následující sloučeniny:

- 1-(4-chlorfenoxy)-3,3-dimethyl-2-methoxymethylkarbamoyloxy-1-(1,2,4-triazol-1-yl)butan,
- 1-(2,4-dichlorfenoxy)-3,3-dimethyl-2-methoxymethylkarbamoyloxy-1-(1,2,4-triazol-1-yl)butan,
- 1-(4-chlorfenoxy)-3,3-dimethyl-2-trifluormethylkarbamoyloxy-1-(1,2,4-triazol-1-yl)butan,
- 1-(4-bifenylloxy)-3,3-dimethyl-2-trifluormethylkarbamoyloxy-1-(1,2,4-triazol-1-yl)butan.

Účinné látky podle vynálezu mají silné fungitoxické účinky. V koncentracích nut-

ných k potírání hub nepoškozují kulturní rostliny. Z těchto důvodů jsou vhodné jakožto prostředky k ochraně rostlin za účelem potírání hub. Fungitoxické prostředky se při ochraně rostlin používají k potírání hub ze třídy Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes, Deuteromycetes.

Účinné látky podle vynálezu mají široké spektrum účinku a mohou se používat proti parazitickým houbám, které napadají nadzemní části rostlin, a proti houbám, které napadají rostliny z půdy, jakož i proti původcům chorob přenosných semenem. Zvláště dobrý účinek mají tyto prostředky proti houbám parazitujícím na nadzemních částech rostlin.

Jako prostředky k ochraně rostlin je možno účinné látky podle vynálezu používat zvláště úspěšně k potírání hub druhu *Venturia*, jako jsou například původci padlí jabloňového (*Fusicladium dendriticum*), proti druhům *Uromyces*, jako je například původce rzi fazolové (*Uromyces phaseoli*), jakož i k potírání druhů *Phytophthora* a k potírání chorob obilovin.

Jako prostředky k ochraně rostlin se mohou účinné látky podle vynálezu používat k moření osiva nebo k ošetřování půdy a k ošetřování nadzemních částí rostlin.

Účinné látky se mohou převádět na obvyklé prostředky, jako jsou roztoky, emulze, smáčitelné prášky, suspenze, prášky, popraše, pěny, pasty, rozpustné prášky, granuláty, aerosoly, koncentráty na bázi suspenzí a emulzí, prášky pro moření osiva, přírodní a syntetické látky impregnované účinnými látkami, malé částice obalené polymerními látkami a obalování hmoty pro osiva, dále na prostředky se zápalnými přísadami, jako jsou kouřové patrony, kouřové dózy, kouřové spirály apod., jakož i na prostředky ve formě koncentrátů účinné látky pro rozptýlení mlhou za studena nebo za tepla.

Tyto prostředky se připravují známým způsobem, například smísením účinné látky s plnidly, tedy kapalnými rozpouštědly, zkapalněnými plyny nacházejícími se pod tlakem nebo/a pevnými nosnými látkami, popřípadě za použití povrchově aktivních činidel, tedy emulgátorů nebo/a dispergátorů nebo/a zpěňovacích činidel. V případě použití vody jako plnidla je možno jako pomocná rozpouštědla používat například takové organická rozpouštědla. Jako kapalná rozpouštědla přicházejí v podstatě v úvahu: aromáty, jako xylen, toluen nebo alkylnaftaleny, chlorované aromáty nebo chlorované alifatické uhlovodíky, jako chlorbenzeny, chlorethyleny nebo methylenchlorid, alifatické uhlovodíky, jako cyklohexan nebo parafiny, například ropné frakce, alkoholy, jako butanol nebo glykol, jakož i jejich ethery a estery, dále ketony, jako aceton, methylethylketon, methylisobutylketon ne-

bo cyklohexanon, silně polární rozpouštědla, jako dimethylformamid a dimethylsulfoxid, jakož i voda. Zkapalněnými plynnými plnidly nebo nosnými látkami se míní takové kapaliny, které jsou za normální teploty a normálního tlaku plynné, například aerosolové propelanty, jako halogenované uhlovodíky, jakož i butan, propan, dusík a kyslíčník uhlíčitý. Jako pevné nosné látky přicházejí v úvahu: přírodní kamenné moučky, jako kaoliny, aluminy, mastek, křída, křemen, attapulgit, montmorillonit nebo křemelina, a syntetické kamenné moučky, jako vysoce disperzní kyselina křemičitá, kyslíčník hlinitý a křemičitany. Jako pevné nosné látky pro přípravu granulátů přicházejí v úvahu drcené a frakcionované přírodní kamenné materiály, jako vápenec, mramor, pemza, sepiolit a dolomit, jakož i syntetické granuláty z organických a organických mouček a granuláty z organického materiálu, jako z pilin, skořápek kokosových ořechů, kukuřičných palic a tabákových stonků. Jako emulgátory nebo/a zpěňovací činidla přicházejí v úvahu neionogenní a anionické emulgátory, jako polyoxyethylenestery mastných kyselin, polyoxyethylenethery mastných alkoholů, například alkylarylpolyglykolether, alkylsulfonáty, alkylsulfáty, arylsulfonáty a hydrolyzáty bílkovin, a jako dispergátory například lignin, sulfátové odpadní louhy a methylcelulóza.

Prostředky podle vynálezu mohou obsahovat adheziva, jako karboxymethylcelulózu, přírodní a syntetické práškové, zrnité nebo latexovité polymery, jako arabskou gumu, polyvinylalkohol a polyvinylacetát.

Dále mohou tyto prostředky obsahovat barviva, jako organické pigmenty, například kyslíčník železitý, kyslíčník titaničitý a ferrokyanidovou modř, a organická barviva, jako alizarinová barviva a kovová azoftalocyaninová barviva, jakož i stopové prvky, například soli železa, manganu, boru, mědi, kobaltu, molybdenu a zinku.

Konzentráty obsahují obecně 0,1 až 95 % hmotnostních, s výhodou 0,5 až 90 % hmotnostních, účinné látky.

Účinné látky podle vynálezu mohou být v příslušných prostředcích obsaženy ve směsi s jinými účinnými látkami, jako fungicidy, insekticidy, akaricidy, nematocidy, herbicidy, ochrannými látkami proti ožeru ptáky, růstovými látkami, živinami pro rostliny a činidly zlepšujícími strukturu půdy.

Účinné látky podle vynálezu je možno aplikovat jako takové, ve formě koncentrátů nebo z nich dalším ředěním připravených aplikačních forem, jako přímo použitelných roztoků, emulzí, suspenzí, prášků, past a granulátů. Aplikace se provádí obvyklým způsobem, například zálivkou, postřikem, poprášením, pohazováním, mokráním za sucha, za vlhka, za mokra nebo v suspenzi, nebo inkrustací.

Při použití účinných látek jako listových

fungicidů se mohou jejich koncentrace v aplikovaných prostředcích pohybovat v širokém rozmezí. Tyto koncentrace obecně jsou 0,1 až 0,00001 % hmot., s výhodou 0,05 až 0,0001 % hmot.

Při ošetřování osiva je obecně zapotřebí na každý kilogram osiva použít 0,001 až 50 g, s výhodou 0,01 až 10 g účinné látky.

K ošetření půdy je třeba použít na každé m³ půdy 1 až 1000 g, s výhodou 10 až 200 g účinné látky.

Mnohostranná použitelnost popisovaných sloučenin vyplývá z následujících příkladů.

Příklad A

Protektivní test na strupovitost jabloní (*Fusicladium*)

Rozpouštědlo:

4,7 hmotnostního dílu acetonu.

Emulgátor:

0,3 hmotnostního dílu alkylarylpolyglykoletheru.

Voda:

95 hmotnostních dílů.

Množství účinné látky potřebné pro dosažení žádané koncentrace účinné látky v kapalném postřiku se smísí s množstvím vody, která obsahuje shora uvedené přísady.

Postřikem se až do orosení postřikají mladé jabloněvé semenáčky ve stadiu 4 až 6 listů. Rostliny se ponechají 24 hodiny ve skleníku při teplotě 20 °C a relativní vlhkosti vzduchu 70 %, načež se inokulují vodnou suspenzí spor houby *Fusicladium dendriticum* (strupovitost jabloní) a inkubují se 18 hodin ve vlhké komoře při teplotě 18 až 20 °C a 100% relativní vlhkosti vzduchu.

Rostliny se pak znovu přenesou na 14 dnů do skleníku.

15 dnů po inokulaci se zjistí napadení semenáčků. Získané hodnoty se přepočtou na napadení v %.

0 % znamená žádné napadení, 100 % znamená úplné napadení rostlin.

Při tomto testu vykazují například následující sloučeniny velmi dobrý účinek, který zřetelně převyšuje účinek sloučenin známých ze stavu techniky:

sloučeniny podle příkladů ilustrujících způsob výroby účinných látek 1, 2, 8, 16 a 17.

Příklad B

Test na rez fazolovou (*Uromyces phaseoli*), protektivní účinek

Rozpouštědlo:

4,7 hmotnostního dílu acetonu.

Emulgátor:

0,3 hmotnostního dílu alkylarylpolyglykoletheru.

Voda:

95 hmotnostních dílů.

Množství účinné látky potřebné pro dosažení žádané koncentrace účinné látky v kapalném postřiku se smísí s uvedeným množstvím rozpouštědla a koncentrát se zředí udaným množstvím vody, obsahující shora zmíněné přísady.

Kapalným postřikem se až do orosení postříkají mladé rostliny fazolu ve stadiu dvou listů. Ošetřené rostliny se k oschnutí udržují 24 hodiny ve skleníku při teplotě 20 až 22 °C a relativní vlhkosti vzduchu 70 procent, načež se inokulují vodnou suspenzí uredospor rzi fazolové (*Uromyces phaseoli*) a 24 hodiny se inkubují v tmavé vlhké komoře při teplotě 20 až 22 °C a 100% relativní vlhkosti vzduchu.

Rostliny se pak 9 dnů udržují ve skleníku za intenzivního osvětlování při teplotě 20 až 22 °C a 70- až 80% vlhkosti vzduchu.

10 dnů po inokulaci se určí napadení rostlin. Získané hodnoty se přepočítají na % napadení. 0 % znamená žádné napadení a 100 % znamená úplné napadení rostlin.

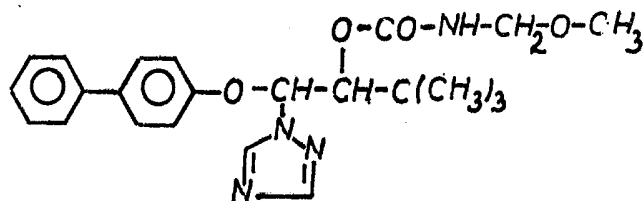
Při tomto testu vykazují například následující sloučeniny velmi dobrý účinek, který zřetelně převyšuje účinek sloučenin známých ze stavu techniky:

sloučeniny podle příkladů ilustrujících způsob výroby účinných látek 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 13, 14, 15, 16, 17.

Příklad C

Test na plíseň bramborovou (*Phytophthora*) — protektivní účinek/rajče

Rozpouštědlo:



(Postup a)

505 g (1,5 molu) 1-(4-bifenyloxy)-3,3-dimethyl-1-(1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-olu (A-forma) a 140 g (1,6 molu) methoxymethylisokyanátu se zahřívá v 2,5 litru tetrahydrofuranu v přítomnosti 40 ml triethylaminu a 1 ml dibutylcindilaurátu 48 hodin k varu pod zpětným chladičem. Potom se rozpouštědlo odpaří ve vakuu a ke

4,7 hmotnostního dílu acetonu.

Emulgátor:

0,3 hmotnostního dílu alkylarylpolyglykoletheru.

Voda:

95 hmotnostních dílů.

Množství účinné látky potřebné k dosažení žádané koncentrace účinné látky v postřikové kapalině se smísí s uvedeným množstvím rozpouštědla a koncentrát se zředí udaným množstvím vody, která obsahuje uvedené přísady.

Postřikovou kapalinou se až do orosení postříkají mladé rostliny rajčat ve stadiu 2 až 4 listů. Rostliny se nechají 24 hodin při teplotě 20 °C a při relativní vlhkosti vzduchu 70 % ve skleníku. Potom se rostliny rajčat inokulují vodnou suspenzí spor plísně bramborové (*Phytophthora infestans*). Rostliny se přenesou do vlhké komůrky, kde se udržují při 100% relativní vlhkosti vzduchu a teplotě 18 až 20 °C.

Po 5 dnech se zjistí napadení rostlin rajčat a ze získaných výsledků se vypočte napadení v %. 0 % znamená žádné napadení, 100 % znamená úplné napadení rostlin.

Při tomto testu vykazují například následující sloučeniny velmi dobrý účinek, který zřetelně převyšuje účinek sloučenin známých ze stavu techniky:

sloučeniny podle příkladů 1, 5, 8, 16 a 17.

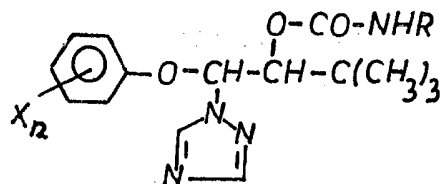
Příklady ilustrující způsob výroby účinných látek

Příklad 1

zbytku se přidají 3 litry petroletheru. Vzniklá krystalická sraženina se rozmíchá s 1,5 litru diisopropyletheru. Získá se 528 g (82,5 procenta teorie) 1-(4-bifenyloxy)-3,3-dimethyl-2-methoxymethylkarbamoyloxy-1-(1,2,4-triazol-1-yl)butan (A-forma) o teplotě tání 95 až 98 °C.

Analogickým způsobem byly získány sloučeniny uvedené v následující tabulce 1.

TABULKA 1

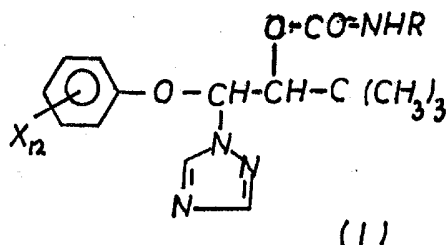


Příklad číslo	X _n	R	Teplota tání (°C)
2		—(CH ₂) ₂ —Cl	138—141 (B-forma)
3		—CO—OCH ₃	184—185 (B-forma)
4		—CO—OC ₂ H ₅	164—166 (B-forma)
5		—(CH ₂) ₂ —Cl	103—105 (A-forma)
6		—CO—OCH ₃	103—105 (A-forma)
7		—CO—OC ₂ H ₅	100 (A-forma)
8		—CH ₂ —O—CH ₃	141—144 (B-forma)
9		—CO—N—SO ₂ CH ₃	141—144 (B-forma)
10		—(CH ₂) ₂ —CH(CH ₃)—CH ₂ —C(CH ₃) ₃	109—115 (B-forma)
11			194—200
12			158—165
13			193—206
14			148—155
15	4-Cl	—CO—OCH ₃	151—154 (A-forma)
16		—CH ₂ —O—C ₂ H ₅	140 (xHCl)
17		—(CH ₂) ₃ —O—CH ₃	100 (xHCl)

A- a B-forma = vždy jeden z obou možných geometrických isomerů

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Fungicidní prostředek, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jeden karbamoyltriazolyl-O,N-acetal obecného vzorce I,

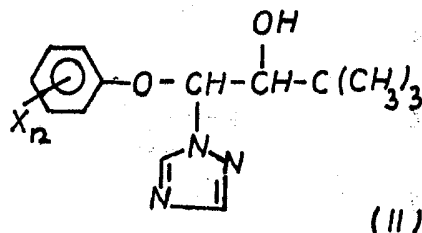


v němž znamená

R alkylovou skupinu s 5 až 12 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a s 1 až 5 atomy halogenu, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové i alkoxylové části, fenylovou skupinu, která je substituována jednou nebo několikrát alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinou s 1 až 2 atomy uhlíku, jakož i alkoxykarbonylalkenylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části a s 2 až 4 atomy uhlíku v alkenylové části, přičemž uvedené substituenty mohou být stejné nebo vzájemně rozdílné, a dále znamená alkylsulfonalkenyl-karbamoylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části a s 2 až 4 atomy uhlíku v alkenylové části,

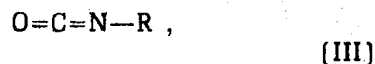
X halogen nebo fenylovou skupinu, a n celá čísla od 0 do 5, nebo jeho fyziologicky použitelnou adiční sůl s kyselinou nebo komplexní sloučeninu se solemi kovů.

2. Způsob výroby účinných látek podle bodu 1 obecného vzorce I, vyznačující se tím, že se triazolylové deriváty obecného vzorce II,



v němž

X a n mají význam uvedený pod vzorcem I, uvádějí v reakci s isokyanáty obecného vzorce III,



v němž

R má shora uvedený význam, v přítomnosti rozpouštědla a popřípadě v přítomnosti katalyzátoru, načež se získané sloučeniny popřípadě převedou adicí kyselin nebo solí kovů na příslušné soli, popřípadě na kovové komplexní sloučeniny.