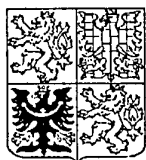


ČESKÁ
REPUBLIKA

(19)



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: **4728-90**

(22) Přihlášeno: 28. 09. 90

(30) Právo přednosti:
30. 09. 89 DE 89/3932752

(40) Zveřejněno: 15. 12. 94

(47) Uděleno: 28. 02. 95

(24) Oznámeno udělení ve Věstníku: 17. 05. 95

(13) Druh dokumentu: **B6**

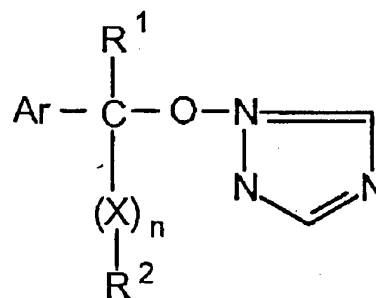
(51) Int. Cl.⁶:
C 07 D 249/08
A 01 N 43/653

(73) Majitel patentu:
BASF AKTIENGESELLSCHAFT,
Ludwigshafen, DE;

(72) Původce vynálezu:
Sauter Hubert dr., Mannheim, DE;
Zierke Thomas dr., Boehl-Iggelheim, DE;
Reuther Wolfgang dr., Heidelberg, DE;
Baus Ulf dr., Dossenheim, DE;
Lorenz Gisela dr., Neustadt, DE;
Ammermann Eberhard dr., Ludwigshafen,
DE;

(54) Název vynálezu:
**1,2,4-Triazolový derivát a fungicidní
prostředek obsahující tuto sloučeninu**

(57) Anotace:
Je popsán 1,2,4-triazolový derivát obecného vzorce I, ve kterém Ar znamená fenylovou skupinu, která obsahuje jeden nebo dva substituenty vybrané z atomu fluoru, atomu chloru a trifluormethylové skupiny, R¹ znamená atom vodíku nebo v případě, že n představuje číslo nulu, dále 2,2-dichlorvinyllovou skupinu, dále fenylovou nebo 2-fenylethylovou skupinu, přičemž fenylový kruh v těchto skupinách může obsahovat jeden nebo dva atomy fluoru nebo chloru, nebo dále isoxazol-5-yllovou skupinu, která v poloze 3 obsahuje substituent vybraný z alkylové skupiny se 3 nebo 4 atomy uhlíku, cyklopentylové skupiny nebo 4-terc.-butylfenylové skupiny, X znamená atom síry nebo skupinu vzorce CH₂ a n představuje číslo nula nebo 1 a fungicidní prostředek, který obsahuje pevnou nebo kapalnou nosnou látku a fungicidně účinné množství 1,2,4-triazolového derivátu obecného vzorce I.



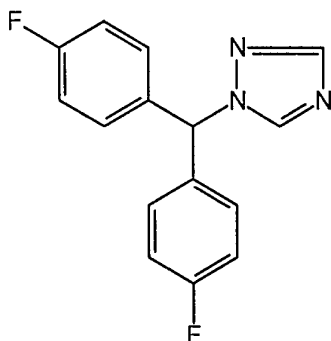
1,2,4-Triazolový derivát a fungicidní prostředek obsahující tuto sloučeninu

Oblast techniky

Tento vynález se týká nových 1,2,4-triazolových derivátů a fungicidních prostředků, které obsahují kromě pevné nebo kapalně nosné látky fungicidně účinné množství takového 1,2,4-triazolového derivátu. Dále se zde popisuje způsob výroby takových sloučenin a jejich použití, jakož i způsob hubení hub a popřípadě také regulace růstu rostlin těmito účinnými látkami.

Dosavadní stav techniky

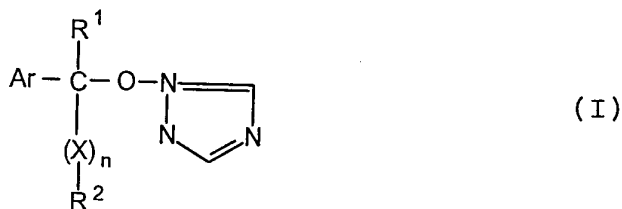
Z evropského patentu č. 165 777 jsou známy azolové deriváty, jako například 1-bis(4-fluorfenyl)-(1H-1,2,4)triazol vzorce



které působí jako inhibitory aromatasy. Jejich fungicidní účinek však není dostačující.

Podstata vynálezu

Nyní byly nalezeny nové 1,2,4-triazolové deriváty obecného vzorce I



ve kterém

Ar znamená fenylovou skupinu, která obsahuje jeden nebo dva substituenty vybrané z atomu fluoru, atomu chloru a trifluor-methylové skupiny,

R^1 znamená atom vodíku nebo v případě, že n představuje číslo nulu, dále znamená kyanoskupinu,

R^2 znamená alkylovou skupinu se 2 až 5 atomy uhlíku,

2,2-dichlorvinyllovou skupinu,

fenylovou nebo 2-fenylethylovou skupinu, přičemž fenylový kruh v těchto skupinách může nést jeden nebo dva atomy fluoru nebo chloru, nebo

isoxazol-5-yllovou skupinu, která v poloze 3 nese substituent vybraný z alkylové skupiny se 3 nebo 4 atomy uhlíku, cyklopentyllové skupiny nebo 4-terc.-butylfenylové skupiny,

X znamená atom síry nebo skupinu vzorce CH_2 a

n představuje číslo nula nebo 1,

které mají velmi vysoký fungitoxický účinek při vynikající snášenlivosti s rostlinami.

Sloučeniny obecného vzorce I mají obecně chirální centra. Tyto sloučeniny se získávají jako racemáty nebo směsi diastereomerů. Diastereomerně čisté sloučeniny se mohou izolovat destilací, sloupcovou chromatografií nebo na základě rozdílné rozpustnosti. Enantiomerně čisté sloučeniny se mohou získat například štěpením racemátu, prováděným působením chirálních pomocných reagensů známými způsoby, například přes diastereomerní soli.

Pro použití nových sloučenin jako fungicidů jsou vhodné jak diastereomery nebo enantiomery, tak také směsi stereomerů vznikající při syntéze. Všechny tyto sloučeniny jsou zahrnuty do rozsahu tohoto vynálezu.

Ve sloučeninách obecného vzorce I podle tohoto vynálezu:

Ar znamená například fenyl, 4-fluorfenyl, 4-chlorfenyl, 4-trifluormethylfenyl, 2,4-dichlorfenyl, 2,6-dichlorfenyl, 3,4-dichlorfenyl, 3-trifluormethylfenyl, 3-fluorfenyl, 2-fluorfenyl, 2-chlorfenyl, 4-fluor-2-chlorfenyl, 4-chlor-2-fluorfenyl, 3-chlorfenyl a 3,5-dichlorfenyl.

R^2 znamená například alkyl se 2 až 5 atomy uhlíku, zejména ethyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, 2-butyl, terc.-butyl, pentyl, 2-pentyl, neopentyl a dále 2-(4-chlorfenyl)ethyl, 2-(4-fluorfenyl)ethyl, 2-(2,4-dichlorfenyl)ethyl, 2-(2-chlorfenyl)ethyl, 2-(2-chlor-4-fluorfenyl)ethyl, 4-chlorfenyl, fenyl, 4-fluorfenyl, 4-chlorfenyl, 4-trifluormethylfenyl, 2,4-dichlorfenyl, 2,6-dichlorfenyl, 3,4-dichlorfenyl, 3-trifluormethylfenyl, 3-fluorfenyl, 2-fluorfenyl, 2-chlorfenyl, 4-fluor-2-chlorfenyl, 4-chlor-2-fluorfenyl, 3-chlorfenyl a 3,5-dichlorfenyl.

Nové 1,2,4-triazolové deriváty se získají způsobem, který se popisuje v příkladu 1 nebo způsobem, který je zcela analogický.

Přitom používané výchozí sloučeniny obecného vzorce II



ve kterém

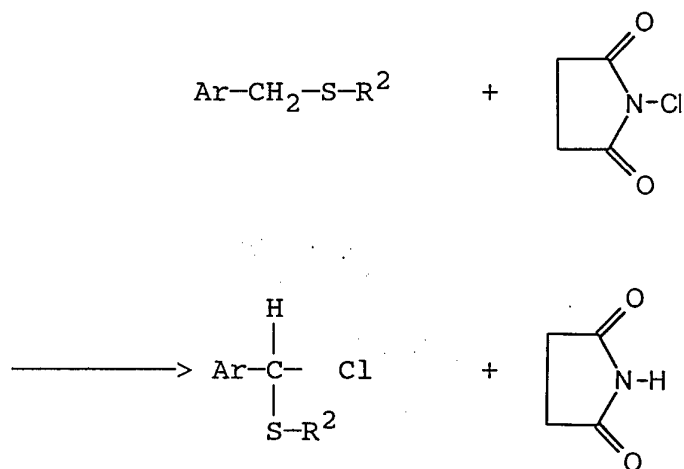
Ar, R^1 , R^2 , X a n mají významy uvedené shora a

Z představuje nukleofugní odštěpitelnou skupinu, jako je atom chloru nebo bromu, methansulfonátový, benzensulfonátový nebo 4-tolylsulfonátový zbytek,

jsou známé z literatury nebo se obecně mohou vyrábět způsoby známými z literatury.

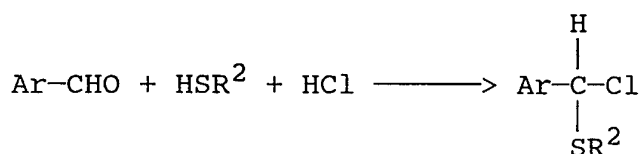
A) Tak se například obdrží α -chlorsulfidy vzorce II ($\text{X}=\text{S}$, $\text{Z}=\text{Cl}$, $\text{R}^1=\text{H}$)

a) chlorací sulfidů N-chlorsukcinimidem (viz například B. L. Tuleen a T.B. Stephens J. Org. Chem., 34, 31 (1969)) například podle schéma



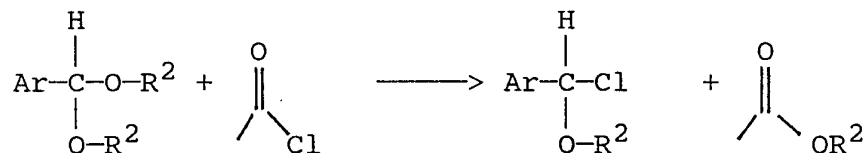
nebo

b) reakcí aldehydů s thioly v přítomnosti chlorovodíku (viz například H. Böhmer, H. Fischer a R. Frank Liebigs Ann. Chem. 563, 54 1949) podle schéma

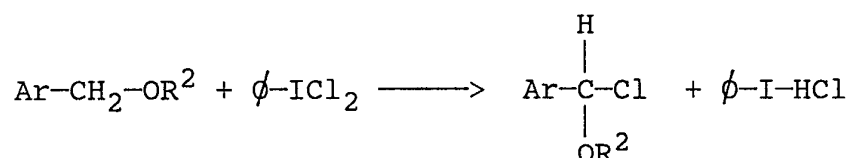


B) α -Chlorether vzorce II ($X=O$, $n=1$, $Z=Cl$, $R^1=H$) se získá například

a) reakcí acetalů s acetylchloridem (viz např. D. M. Bailey J. Med. Chem. 17, 702 1974) podle schéma



b) chlorací etherů (viz například E. Vilsmeier Liebigs Ann. Chem. 728, 12 (1969)) podle schéma



c) Sloučeniny vzorce II, ve kterých X značí CH_2 , R^1 značí H a n je 0 nebo 1, se získají buď

a) reakcí aldehydů vzorce VII



s 0,8 až 1,2 ekvivalenty Grignardovy sloučeniny vzorce VIII



nebo

b) reakcí aldehydů vzorce IX



s 0,8 až 1,2 ekvivalenty Grignardovy sloučeniny vzorce X



nebo

c) redukcí ketonů vzorce XI



například

- c₁) působením komplexních hydridů, zejména natriumborhydridu v přítomnosti polárního rozpouštědla, například alkoholu, zejména methanolu nebo ethanolu při teplotách mezi 0 a 80 °C, nebo
- c₂) působením vodíku v přítomnosti hydrogenačního katalysátoru jako platiny nebo Raneyova niklu v přítomnosti polárního rozpouštědla jako methanolu, ethanolu nebo ethylacetátu při teplotách mezi 20 a 100 °C a tlacích od 1.10⁵ Pa až 100.10⁵ Pa

na sloučeniny vzorce XII

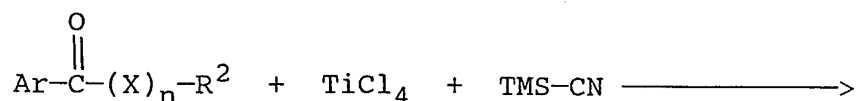


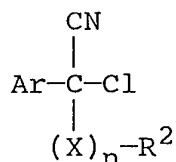
které se potom ve druhém stupni převodu ve sloučeniny vzorce II a to, když

- a) Z znamená chlor, reakcí s thionylchloridem popřípadě v přítomnosti rozpouštědla jako methylenchloridu nebo chloroformu, při teplotách mezi 20 až 70 °C, nebo když
- b) Z znamená brom, reakcí s fosfortribromidem popřípadě v přítomnosti rozpouštědla jako methylenchloridu nebo chloroformu při teplotách mezi 0 až 70 °C, zejména 20 a 30 °C, nebo když
- c) Z znamená methansulfonát, benzensulfonát nebo 4-tolylsulfonát, reakcí s vhodnými chloridy kyselin sulfonových nebo anhydridy, popřípadě v přítomnosti organické báze jako triethylaminu, dimethylcyklohexylaminu, diethylcyklohexylaminu, pyridinu, 4-N, N-dimethylaminopyridinu a popřípadě v přítomnosti zředovacího prostředku jako methyl-terc. butyletheru, diethyletheru, tetrahydrofuranu, methylenchloridu, chloroformu, pentanu, hexanu, cyklohexanu nebo toluenu, při teplotě mezi 20 a 150 °C.

Sloučeniny vzorce II ve kterých X značí CH₂, R¹ značí nitril, n značí 0 nebo 1 a Z značí chlor se získají například

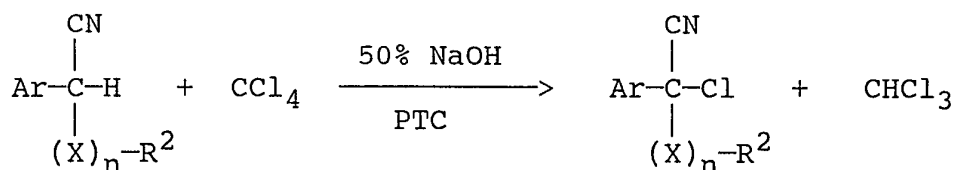
- a) reakcí ketonů s titantetrachloridem v přítomnosti trimethylsilylkyanidu (TMS-CN) (viz například S. Kiyooka, R. Fujiyama, K. Kawaguchi Chem. Lett. 1979-80 (1984)) podle schéma





nebo

- b) chlorací nitrilů chloridem uhličitým v přítomnosti 50% louhu sodného za podmínek fázového transferu (PTC) (viz například A. Jonczyk, A. Kwast, M. Makosza, Z. Org. Chem. 44, 1192-4, (1979)) podle schéma



Následující příklady popisují výrobu nových sloučenin.

Příklady provedení vynálezu

Příklad 1

a) Výroba 1-hydroxy-1,2,4-triazolu a jeho draselné sole 103,5 g (1,5 mol) 1-H-1,2,4-triazolu se rozpustí ve 1 344 g (12 mol) 50% vodného hydroxidu draselného. Za chlazení ledem se přidá 340 g (3 mol) 30% H_2O_2 , po částech 555 g (3,75 mol) anhydridu kyseliny ftalové a 2 hodiny se míchá při teplotě místnosti (20 až 30 °C). Potom se cca 35% kyselinou sírovou okyselí na hodnotu pH pod 1,5, vzniklá sraženina se odsaje a filtrát se zkouší měřením vysokotlakou kapalinovou chromatografií (HPLC). Získá se 65 g (51 %), který se zpracuje obvyklým způsobem.

T. t.: 132 °C.

10 g 1-hydroxy-1,2,4-triazolu (117 mmol) se rozpustí s 300 ml dimethylformamidu. Potom se přidá 13,2 g (117 mmol) methanolátu draselného (50 %) a 100 ml methanolu. Směs se zahřívá a směs $\text{MeOH}/\text{H}_2\text{O}$ se azeotropicky oddestiluje. Přidá se znovu 50 ml MeOH a směs s vodou se znovu azeotropicky oddestiluje. Roztok draselné sole 1-hydroxy-1,2,4-triazolu v DMF se může buď přímo nechat dále reagovat, nebo se úplně odpaří rozpouštědlo a získá se bezbarvá sraženina, která se použije dále.

b) Výroba di-(4-fluorfenyl)-chlormethanu

K 33 g 4,4'-difluordifenylmethylkarbinolu rozpuštěným ve 150 ml dichlormethanu se přidá 15 g bezvodého, práškového chloridu vápenatého a do směsi se za míchání při 5 až 10 °C uvádí suchý chlorovodík. Po 2 h se CaCl_2 oddělí dekantací a roztok se zahustí ve vakuu. Získá se 34 g di-(4-fluorfenyl)-chlormethanu jako bleďelutá kapalina.

c) Výroba di-(4-fluorfenyl)-(1,2,4-triazol-1-yl-1-oxy)methanu
(Sloučenina č. 1)

K 1,5 g draselné sole 1-hydroxy-1,2,4-triazolu ve 100 ml dimethylformamidu se přidá 100 mg jodidu draselného a 2,9 g di-(4-fluorfenyl)-chlormethanu a míchá se 2 h při teplotě místnosti. Po odpaření rozpouštědla ve vakuu se zbytek vyjme do 50 ml methyl-terc. butyletheru a dvakrát se vytřepe s vodou. Po zahustění organické fáze zůstává 3,3 g bleděžlutého oleje, který se přes krátký sloupec silikagelu chromatografuje dichlormethanem. Výtěžek 2,0 g světlého oleje.

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, CDCl_3): 6,5 ppm (1H, s); 7,0-7,4 ppm (8H, m); 7,5 ppm (1H, s); 7,8 ppm (1H, s)

Příklad 2

Výroba 2,4-dichlorfenyl-fenylthio-(1,2,4-triazol-1-yl-1-oxy)-methanu (Sloučenina č. 2)

Ve 100 ml tetrachlormethanu se při 0 °C 2 hodiny míchá 26,9 g 2,4-dichlorbenzyl-fenyl-sulfinu a 13,4 g N-chlorsukcinimidu, násada se potom nechá zahřát na teplotu místnosti a míchá se dalších 48 h. Potom se sukcinimid suspendovaný ve směsi odfiltruje a z filtrátu se ve vakuu odstraní rozpouštědlo. Zůstává 30,3 g α -chlor-2,4-dichlorbenzyl-fenyl-sulfidu jako olej.

4,6 g tohoto oleje se přikape ke směsi 1,5 g draselné sole 1-hydroxy-1,2,4-triazolu a 0,3 g jodidu draselného ve 30 ml DMF. Podle kontroly chromatografií na tenké vrstvě (DC) je reakce ukončena po 2 hodinovém míchání při teplotě místnosti. Odpaří se DMF ve vakuu, ke zbytku se přidá 50 ml vody a třikrát se extrahuje vždy 50 ml methyl-terc. butyletheru. Spojené organické roztoky se promyjí 30 ml vody, suší se síranem hořečnatým, ve vakuu se zahustí (4,7 g oleje) a potom se na silikagelovém sloupci diethyletherem chromatografuje. Po 0,1 g přední frakce, která se odstraní, se získá 1,0 g 2,4-dichlorbenzylfenylthio-(1,2,4-triazol-1-yl-1-oxy)-methanu jako bleděžlutý olej.

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, CDCl_3): 6,7 ppm (1H, s); 7,1-7,6 ppm (8H, m); 7,9 ppm (1H, s); 8,5 ppm (1H, s).

Příklad 3

a) 2-Chlor-2,2-di-(4-fluorfenyl)-acetonitril

Pod dusíkem se v 50 ml CH_2Cl_2 rozpustí 4,4 g (20 mmol) 4,4'-difluorbenzofenonu. Potom se postupně při 0 °C přidá 2,7 ml (24 mmol) titantetrachloridu a 2,7 ml (20 mmol) trimethylsilylkyanidu. Po 30 min se směs nechá zahřát na teplotu místnosti a míchá se ještě 24 h. Po přidání vodného roztoku NaHCO_3 se extrahuje etherem. Etherová fáze se suší Na_2SO_4 . Produkt se získá jako žlutý olej.

Výtěžek: 5 g

IR: 1 602 cm^{-1} , 1 508 cm^{-1} , 1 239 cm^{-1} , 1 163 cm^{-1} , 835 cm^{-1}

b) Kyano-di-(4-fluorfenyl)-(1,2,4-triazol-1-yl-1-oxy)methan
(Sloučenina č. 3)

Pod dusíkem se předloží 1,5 g (12 mmol) draselné sole N-hydroxytriazolu ve 20 ml abs. DMF. Do tohoto roztoku se při lehce exothermní reakci kape DMF-roztok 3,16 g (12 mmol) 2-chloro-2,2-di-(4-fluorfenyl)-acetonitrilu. Míchá se ještě 3 h při teplotě místnosti. Reakční roztok se zahustí, dá se do vody a extrahuje se ethylacetátem. Produkt se z acetátu získá jako bleděžlutý olej, který po rozetření s diisopropyletherem vykristaluje.

Výtěžek: 2,5 g

Teplota tání 124 °C

H-NMR: 7.15 ppm, t (4H); 7.4-7.6 ppm, m (4H); 7.72 ppm, s (1H); 7.78 ppm, s (1H)

Příklad 4

1-(2,4-Dichlorfenyl)-1-(1,2,4-triazol-1-yl-1-oxy)-butan
(Sloučenina č. 33)

Ve 100 ml DMF se rozpustí 1,2 g (10 mmol) draselné sole 1-hydroxy-1,2,4-triazolu a při teplotě místnosti se přidá k roztoku 4,0 g (10 mmol) 1-brom-1-(2,4-dichlorfenyl)butanu v 50 ml DMF. Ke směsi se přidá 0,1 g jodidu draselného a 10 minut se zahřívá na teplotu zpětného toku. Potom se rozpouštědlo ve vakuu odstraní, zbytek se vyjme do etheru a třikrát se promyje vodou. Po sušení organické fáze Na_2SO_4 se rozpouštědlo odstraní ve vakuu. Výtěžek: 2,7 g hnědého oleje (94 %), který se čistí sloupcovou chromatografií (silikagel, acetát: cyklohexan (1:1)).

Stejným způsobem je možno vyrobit dále uvedené sloučeniny obecného vzorce I.

Pří- klad č.	Ar	R ¹	(X) _n	R ²	¹ H-NMR (ppm) T.t. (°C) popřípadě IR (cm ⁻¹)
1	4-Fluorfenyl	H	-	4-Fluorfenyl	v.př. 1
2	2,4-Dichlorfenyl	H	S	Fenyl	v.př. 2
3	4-Fluorfenyl	CN	-	4-Fluorfenyl	v.př. 3
4	4-Fluorfenyl	H	-	2-Chlorfenyl	1 510, 1 235, 1 003, 832, 757 681 cm ⁻¹
5	4-Fluorfenyl	H	-	2-Fluorfenyl	1 511, 1 491, 1 234, 1 003, 760, 681 cm ⁻¹
6	4-Fluorfenyl	H	S	2-Chlorfenyl	1 509, 1 451, 1 233, 1 226, 1 125, 1 005, 891, 843, 766, 679 cm ⁻¹
7	4-Fluorfenyl	H	CH ₂	2-Chlorfenyl	1 606, 1 511, 1 436, 1 228 1 004, 838, 754, 681 cm ⁻¹
8	Fenyl	H	-	4-Fluorfenyl	1 511, 1 275, 1 229, 1 004, 832, 699, 681 cm ⁻¹
9	2-Fluorfenyl	H	-	Fenyl	1 490, 1 452, 1 274, 1 241, 1 003, 943, 762, 698, 681 cm ⁻¹
10	3-Trifluormethylfenyl	H	-	Fenyl	1 333, 1 168, 1 127, 1 075, 701, 682 cm ⁻¹
11	4-Chlorfenyl	H	-	2,2-Dichlorvinyl	73 až 75 °C
12	2,4-Dichlorfenyl	H	S	4-Chlorfenyl	85 až 87 °C
13	2,4-Dichlorfenyl	H	S	Ethyl	1 589, 1 497, 1 472, 1 275, 866, 856 cm ⁻¹
14	4-Fluorfenyl	H	-	2-Trifluormethylben- zyl	
15	4-Fluorfenyl	H	-	2-Brombenzyl	

Pří- klad č.	Ar	R ¹	(X) _n	R ²	¹ H-NMR (ppm) T.t. (°C) popřípadě IR (cm ⁻¹)
16	4-Fluorfenyl	H	-	2-Methylbenzyl	
17	Fenyl	H	-	2-Chlorfenyl	1 490, 1 270, 1 130, 1 050, 748 cm ⁻¹
18	Fenyl	H	CH ₂	2-Chlorfenyl	
19	Fenyl	H	-	2-(4-Chlorfenyl)ethyl	
20	4-Fenylfenyl	H	-	terc. butyl	
21	4-Fenylfenyl	H	-	n-Butyl	
22	4-Fenoxyfenyl	H	-	n-Hexyl	
23	4-Fenoxyfenyl	H	S	terc. Butyl	
24	4-Fenylfenyl	H	S	terc. Butyl	
25	4-Chlorfenyl	H	S	terc. Butyl	
26	4-Chlorfenyl	H	CH ₂	terc. Butyl	
27	2-Chlor-4-(4-chlor- fenoxy)-fenyl	H	S	terc. Butyl	
28	2-Chlor-4-(4-chlor- fenoxy)-fenyl	H	S	Ethyl	
29	2-Chlor-4-(4-chlor- fenoxy)-fenyl	H	S	Methyl	
30	2-Chlor-4-(4-chlor- fenoxy)-fenyl	H	S	2-Methylpropyl	
31	4-Chlorfenyl	H	-	2-Cyklopropyl-2-ethyl	
32	4-Methylfenyl	H	-	2-Cyklopropyl-2-ethyl	
33	2,4-Dichlorfenyl	H	-	n-Propyl	1 510, 1 470, 1 380, 1273 1 240, 1 100, 965, 680 cm ⁻¹
34	2,4-Dichlorfenyl	H	-	n-Hexyl	
35	2,4-Dichlorfenyl	H	S	Methyl	
36	1-Naftyl	H	S	n-Propyl	
37	2-Naftyl	H	S	n-Butyl	
38	2,4-Dichlorfenyl	H	S	Cyklohexyl	

Pří- klad č.	Ar	R ¹	(X) _n	R ²	¹ H-NMR (ppm) T.t. (°C) popřípadě IR (cm ⁻¹)
39	2-Chlor-4-(4-chlor- fenoxy)-fenyl	H	-	Ethyl	
40	2-Chlor-4-(4-chlor- fenoxy)-fenyl	H	-	n-Butyl	
41	4-(4-chlorfenoxy)- fenyl	H	-	n-Propyl	
42	2-Thienyl	H	-	2-Chlorfenyl	
43	2-Thienyl	H	S	4-Chlorfenyl	
44	2-Thienyl	H	CH ₂	2-Bromfenyl	
45	3-Thienyl	H	-	2-Trifluormethylfenyl	
46	3-Thienyl	H	S	2-Chlorfenyl	
47	2-Pyridyl	H	-	2-Chlorfenyl	
48	2-Pyridyl	H	-	4-Chlorfenyl	
49	4-Chlor-2-pyridyl	H	-	2-Chlorfenyl	
50	4-Chlor-2-pyridyl	H	-	4-Fluorfenyl	
51	4-Chlor-2-pyridyl	H	-	n-Propyl	
52	4-Chlor-2-pyridyl	H	-	2-Methylpropyl	
53	4-Chlor-2-pyridyl	H	S	n-Butyl	
54	4-Methoximino-fenyl	H	-	n-Butyl	
55	4-Ethoximinofenyl	H	S	terc. Butyl	
56	4-Isopropoximino	H	S	terc. Butyl	
57	4-Methoximino	H	S	Ethyl	
58	4-Methoximino	H	S	n-Hexyl	
59	4-Methoximino	H	S	2-Chlorfenyl	
60	4-Ethoximino	H	-	Fenyl	
61	4-n-Butoximino	H	S	n-Butyl	
62	4-Methoximino	H	CH ₂	fenyl	
63	4-Methoximino	H	CH ₂	2-Chlorfenyl	
64	4-Methoximino	H	CH ₂	terc. Butyl	

Pří- klad č.	Ar	R ¹	(X) _n	R ²	¹ H-NMR (ppm) T.t. (°C) popřípadě IR (cm ⁻¹)
65	Fenyl	H	CH ₂	2,4-Dichlorfenyl	
66	4-Fluorfenyl	H	CH ₂	4-Chlorbenzyl	
67	2,4-Dichlorfenyl	H	CH ₂	n-Propyl	
68	Fenyl	H	CH ₂	3-Fenyl-1-propyl	
69	Fenyl	H	O	Fenyl	
70	Fenyl	H	O	2-Chlorfenyl	
71	Fenyl	H	O	Benzyl	
72	Fenyl	H	O	terc. Butyl	
73	4-Fluorfenyl	H	O	terc. Butyl	
74	4-Chlorfenyl	H	O	terc. Butyl	
75	2,4-Dichlorfenyl	H	O	n-Butyl	
76	2,4-Dichlorfenyl	H	O	2-methylpropyl	
77	2,4-Dichlorfenyl	H	O	terc. Butyl	
78	4-Fluorfenyl	H	O	2-Chlorfenyl	
79	4-Fluorfenyl	H	O	2,6-Dichlorfenyl	
80	4-Fluorfenyl	H	O	2,4-Dichlorfenyl	
81	4-Fenylfenyl	H	O	n-Butyl	
82	4-terc. Butyl-fenyl	H	S	terc. Butyl	
83	4-terc. Butylfenyl	H	S	n-Butyl	
84	Fenyl	H	-	4-terc. Butylfenyl	
85	2,4-Dichlorfenyl	H	-	4-Methoxyfenyl	
86	4-Fluorfenyl	H	-	2-Methoxyfenyl	
87	4-Fluorfenyl	H	-	4-Fenoxyethyl	
88	4-Fluorfenyl	H	-	4-Fenoxybutyl	
89	Fenyl	H	-	3-Fenoxypropyl	
90	Fenyl	H	-	2-(2-Chlorfenoxy)ethyl-(1)-	
91	4-Fluorfenyl	H	-	3-(2-Fluorfenoxy)propyl-(1)-	

Pří- klad č.	Ar	R ¹	(X) _n	R ²	¹ H-NMR (ppm) T.t. (°C) popřípadě IR (cm ⁻¹)
92	4-Fluorfenyl	H	-	2-Pyridyl	
93	Fenyl	H	-	4-Pyridyl	
94	Fenyl	H	-	2-Thienyl	
95	4-Fluorfenyl	H	-	3-Thienyl	
96	4-Fluorfenyl	H	-	4-Chlor-2-pyridyl	
97	4-Fluorfenyl	H	-	3-Chlor-4-pyridyl	
98	4-Fluorfenyl	H	S	2-Pyridyl	
99	4-Trifluormethylfenyl	H	S	2-Bromfenyl	
100	2,4-Dichlorfenyl	H	S	3-Propinyl-1	
101	2,4-Dichlorfenyl	H	-	Ethinyl	
102	2,4-Dichlorfenyl	H	-	Vinyl	
103	4-Fenylfenyl	H	-	Propenyl	
104	4-Fenylfenyl	H	S	2,3,3-Trichlorpropenyl	
105	Fenyl	CN	-	4-Fluorfenyl	
106	Fenyl	CN	-	2-Chlorfenyl	
107	Fenyl	CN	-	2,4-Dichlorfenyl	
108	4-Fluorfenyl	CN	-	2-Chlorfenyl	1 509, 1 238, 985, 760, 680
109	4-Fluorfenyl	CN	-	4-Chlorfenyl	
110	4-Fluorfenyl	CN	-	2-Chlorbenzyl	
111	4-Fluorfenyl	CN	-	n-Butyl	
112	4-Fluorfenyl	CN	-	terc. Butyl	
113	2,4-Dichlorfenyl	CN	-	Ethyl	
114	2,4-Dichlorfenyl	CN	-	n-Butyl	
115	2,4-Dichlorfenyl	CN	-	2-Methylpropyl	
116	4-Chlorfenyl	CN	-	2-Cyklopropyl-2-ethyl	
117	4-Fluorfenyl	CN	-	2-Cyklopropyl-2-ethyl	
118	4-Chlorfenyl	CN	-	terc. Butyl	

Pří- klad č.	Ar	R ¹	(X) _n	R ²	¹ H-NMR (ppm) T.t. (°C) popřípadě IR (cm ⁻¹)
119	2,4-Dichlorfenyl	CN	-	n-Hexyl	
120	4-Fluorfenyl	CN	-	2-Trifluormethylbenzyl	
121	2-Chlor-4-(4-chlor- fenoxy)-fenyl	CN	-	Ethyl	
122	2-Chlor-4-(4-chlor- fenoxy)-fenyl	CN	-	n-Butyl	
123	4-Fluorfenyl	CN	-	2-Fluorfenyl	1 510, 1 491, 1 454, 1 239 996, 837, 763, 680 cm ⁻¹
124	4-Chlorfenyl	CN	-	2-Chlorfenyl	1 492, 1 274, 1 095, 995, 824, 760, 680 cm ⁻¹
125	Fenyl	H	-	Fenyl	
126	4-Chlorfenyl	H	-	2-Chlorfenyl	
127	4-Chlorfenyl	H	-	Fenyl	1 493, 1 275, 1 239, 1 088, 940, 680 cm ⁻¹
128	4-Chlorfenyl	H	-	4-Chlorfenyl	1 493, 1 275, 1 241, 1 092, 820, 805, 679 cm ⁻¹
129	4-Chlorfenyl	H	-	n-Propyl	1 490, 1 275, 1 240, 1 090, 945, 870, 680 cm ⁻¹
130	4-Fluorfenyl	H	-	n-Propyl	1 510, 1 275, 1 225, 1 005, 835, 680 cm ⁻¹
131	4-Chlorfenyl	H	-	4-Methylbutyl	1 492, 1 270, 1 090, 940, 825
132	4-Chlorfenyl	H	-	3-Isopropylisoxazol- -5-yl	
133	4-Fluorfenyl	H	-	3-Isopropylisoxazol- -5-yl	3.07 (sept, 1H), 6.2 (s, 1H) 6.5 (s, 1H), 7.68 (s, 1H) 7.75 (s, 1H) ppm
134	2,4-Dichlorfenyl	H	-	3-Pyridyl	
135	4-Fluorfenyl	H	-	3-Pyridyl	
136	4-Fluorfenyl	H	-	1,2,4-Triazol-1-yl	
137	4-Methoximinofenyl	H	-	4-Fluorfenyl	

Pří- klad č.	Ar	R ¹	(X) _n	R ²	¹ H-NMR (ppm) T.t. (°C) popřípadě IR (cm ⁻¹)
138	Fenyl	CN	-	2-(4-Chlorfenyl)- ethyl	7.1 (d, 2H), 7.26 (d, 2H), 7.62 (s, 1H), 7.68 (s, 1H) ppm
139	4-Fluorfenyl	CN	-	2-(4-Chlorfenyl)- ethyl	2.45 až 3.08 (m, 4H), 7.65 (s, 1H), 7.8 (s, 1H)
140	4-Chlorfenyl	CN	-	2-(4-Chlorfenyl)ethyl	
141	2,4-Dichlorfenyl	CN	-	2-(4-Chlorfenyl)- ethyl	2.65 až 3.02 (m, 4H), 7.69 (s, 1H), 8.13 (s, 1H)
142	Fenyl	CN	-	2-(4-Fluorfenyl)- ethyl	2.5 až 3.04 (m, 4H), 7.66 (s, 1H), 7.74 (s, 1H)
143	4-Fluorfenyl	CN	-	2-(4-Fluorfenyl)- ethyl	2.5 až 3.06 (m, 4H), 7.65 (s, 1H), 7.85 (s, 1H)
144	4-Chlorfenyl	CN	-	2-(4-Fluorfenyl)- ethyl	2.48 až 3.04 (m, 4H), 7.66 (s, 1H), 7.86 (s, 1H)
145	2,4-Dichlorfenyl	CN	-	2-(4-Fluorfenyl)- ethyl	2.65 až 3.05 (m, 4H), 7.68 (s, 1H), 8.14 (s, 1H)
146	Fenyl	CN	-	2-(Fenyl)ethyl	2.5 až 3.1 (m, 4H), 7.65 (s, 1H), 7.82 (s, 1H)
147	4-Fluorfenyl	CN	-	2-(Fenyl)ethyl	2.66 až 3.08 (m, 4H), 7.7 (s, 1H), 8.15 (s, 1H)
148	4-Chlorfenyl	CN	-	2-(Fenyl)ethyl	
149	2,4-Dichlorfenyl	CN	-	2-(Fenyl)ethyl	2.66 až 3.08 (m, 4H), 7.7 (s, 1H), 8.15 (s, 1H)
150	Fenyl	CN	-	2-(2,4-Dichlorfenyl)- ethyl	
151	4-Fluorfenyl	CN	-	2-(2,4-Dichlorfenyl)- ethyl	
152	4-Chlorfenyl	CN	-	2-(2,4-Dichlorfenyl)- ethyl	
153	2,4-Dichlorfenyl	CN	-	2-(2,4-Dichlorfenyl)- ethyl	
154	4-Fluorfenyl	H	-	2,4-Dichlorfenyl	6.77 (s, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.77 (s, 1H)
155	4-Fluorfenyl	H	-	3-(p-terc. butyl- fenyl)isoxazol-5-yl	1.35 (s, 9H), 6.6 (s, 1H), 6.65 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.78 (s, 1H)

Pří- klad č.	Ar	R ¹	(X) _n	R ²	¹ H-NMR (ppm) T.t. (°C) popřípadě IR (cm ⁻¹)
156	4-Fluorfenyl	H	-	3-terc. butyl- isoxazol-5-yl	1.32 (s, 9H), 6.25 (s, 1H), 6.54 (s, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.76 (s, 1H)
157	4-Fluorfenyl	H	-	3-n-Propylisoxazol- -5-yl	6.2 (s, 1H), 6.55 (s, 1H), 7.72 (s, 1H) 7.78 (s, 1H)
158	4-Fluorfenyl	H	-	3-Cyklopentyliso- xazol-5-yl	6.16 (s, 1H), 6.52 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.77 (s, 1H)
159	4-Fluorfenyl	H	-	3-sek.butylisoxazol- -5-yl	6.17 (s, 1H), 6.53 (s, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.77 (s, 1H)

Nové sloučeniny se vyznačují vynikající účinností proti širokému spektru hub patogenních vůči rostlinám, zejména ze třídy Ascomycet a Basidiomycet. Jsou z části systemicky účinné a mohou se používat jako listové a půdní fungicidy.

Zvláště zajímavé jsou fungicidní sloučeniny pro potírání velkého počtu hub na různých kulturních rostlinách nebo jejich semelech, zejména na pšenici, žitě, ječmeni, ovsu, rýži, kukuřici, trávě, bavlně, soje, kávovníku, cukrové třtině, ovoci a ozdobných rostlinách v zahradnictví, vinařství jakož i na zelenině jako okurkách, fazolích a tykvovitých rostlinách.

Nové sloučeniny jsou zejména vhodné k potírání následujících nemocí rostlin:

Erysiphe graminis (pravé padlí) na obilí,
Erysiphe cichoracearum a Sphaerotheca fuliginea na tykvovitých rostlinách,
Podosphaera leucotricha na jablkách,
Uncinula necator na révě,
Puccinia na obilí,
Rhizoctonia na bavlně a trávě,
Ustilago na obilí a cukrové třtině,
Venturia inaequalis na jablkách,
Helminthospory na obilí,
Septoria nodorum na pšenici,
Botrytis cinerea na jahodách, révě,
Cercospora arachidicola na arašídách,
Pseudocercospora herpotrichoides na pšenici a ovsu,
Pyricularia oryzae na rýži,
Phytophthora infestans plíseň bramborová na bramborách a na rajčatech,
Fusaria a Verticillia na různých rostlinách,
Plasmopara viticola na révě,
Alternaria na zelenině a ovoci.

Sloučeniny se používají tak, že se rostliny účinnými látkami postříkají nebo popráší nebo se semena rostlin účinnými látkami

ošetří. Použití se provádí před nebo o infekci rostlin nebo semen houbami. Fungicidně účinným množstvím účinné látky se ošetří houby nebo rostliny ohrožené houbami, osivo, materiály nebo půda.

Nové sloučeniny mohou různě ovlivnit prakticky všechny vývojová stadia rostliny a mohou se proto používat jako regulátory růstu. Rozmanitost účinku regulátorů růstu rostlin závisí především

- a) na druhu a povaze rostlin,
- b) na době aplikace, vztaženo na vývojové stadium rostliny a na ročním období,
- c) na druhu aplikace a na postupu (moření semen, ošetření půdy nebo listová aplikace),
- d) na klimatických faktorech, například teplotě, množství srážek, mimo to také na délce dní a intenzitě světla,
- e) na povaze půdy (včetně hnojení),
- f) na složení popřípadě na formě použití účinné látky a
- g) na použitých koncentracích aktivní substance.

Z řady různých možností použití regulátorů růstu rostlin podle vynálezu v rostlinářství, zemědělství a zahradnictví, se uvádějí následující.

- A. Sloučeninami použitelnými podle vynálezu je možno silně potlačovat vegetativní růst rostlin, což se projevuje zejména v redukci doby růstu. Ošetřené rostliny vykazují podle toho potlačený růst; mimoto je možno pozorovat tmavší zbarvení listů.

Pro praxi se jako výhodné ukazuje například zmenšení růstu trávy na krajnicích silnic, kolem plotů, kanálových svahů a na travnatých plochách jako v parcích, sportovních zařízeních a ovocnářských plochách, ozdobných trávnicích a letištních plochách, takže se pracovně náročný a drahý sestřih trávníků může redukovat.

V hospodářském zájmu je také stabilnost polehavých kultur jako obilí, rýže, kukuřice, slunečnic a soji. Při tom způsobeném zkrácení stébel a zesílení stébel zmenšuje nebo odstraňuje nebezpečí "polehání" (zlomení) rostlin za nepříznivých povětrnostních podmínek před sklizní.

Praktický význam má také redukce vegetativního růstu u ovocných stromů a jiných dřevin, protože se tím mohou ušetřit výdaje na řez.

Důležité je také použití k potlačování délkového růstu a k časové změně průběhu zrání bavlny. Tím se umožní úplně mechanizovat sklizeň této důležité kulturní rostliny.

Použitím nových sloučenin se také může rozmnožit nebo potlačit postranní rozvětvení rostlin. O to je zájem, když se například u tabákových rostlin má potlačit vytváření postranních výhonků na úkor růstu listů.

Použitím nových sloučenin se například také nechá u ozimé řepky zvýšit odolnost proti mrazu. Přitom se jednak potlačí délkový růst a vývoj bujné (a tím zvláště mrazem napadnutelné) listové popřípadě rostlinné hmoty, jednak se mladé řepkové rostliny po vysetí a před příchodem zimních mrazů vzdor příznivým růstovým podmínkám zdrží ve vegetativním vývojovém sta-

diu. Tím se také odstraní ohrožení mrazem těch rostlin, které mají sklon k předčasnému odkvětu a k přechodu do generativní fáze. Také u jiných kultur, například u ozimového obilí je výhodné, když ošetřením sloučeninami podle vynálezu na podzim sice dobře zakoření, ale do zimy nevcházejí příliš bujně. Tím se může předejít zvýšené citlivosti na mráz a - kvůli relativně malé listové a rostlinné hmotě - napadení různými nemocemi (například napadení houbami). Potlačení vegetativního růstu umožňuje mimoto u mnoha kulturních rostlin hustější porost, takže se dosáhne vyššího výnosu, vztaženo na půdní plochu.

- B. Novými prostředky se může dosáhnout vyšších výnosů nejen rostlinných částí, ale i látek obsažených v rostlinách. Tak je například možné indukovat růst větších množství pupenců, květů, listů, plodů, semen, kořenů a hlíz, zvýšit obsah cukru v cukrovce, cukrové třtině jakož i citrusových plodech, zvýšit obsah proteinu v obilí nebo soje nebo stimulovat gumovníky ke zvýšenému toku latexu.

Účinné látky vzorce 1 mohou působit zvýšení výnosů zásahem do rostlinné látkové výměny popřípadě podporováním nebo potlačováním vegetativního a/nebo generativního růstu.

- C. Sloučeninami vzorce I je možno konečně dosáhnout jak zkrácení popřípadě prodloužení vývojových stadií, tak také urychlení nebo prodloužení zrání sklizňových částí rostlin před nebo po sklizni.

Hospodářským zájmem je například usnadnění sklizně, která se umožňuje časným koncentrovaným spadáváním nebo snížením soudržnosti se stromem u citrusových plodů, oliv nebo u jiných druhů a sort jádrového ovoce, peckového ovoce a skořepinového ovoce. Podpora vytváření dělicí tkáně mezi listovou a výhonkovou osou je také podstatná pro dobře kontrolovatelnou defoliaci užitkových rostlin, například bavlny.

- D. Účinnými látkami se dále může redukovat spotřeba vody rostlin. To je zvláště důležité pro zemědělské užitkové plochy, které musí být zavlažovány uměle s velkými náklady, například v aridních nebo semiaridních územích. Nasazením substancí podle vynálezu se může intenzita zavlažování redukovat, a tím hospodařit levněji. Pod vlivem regulátorů růstu dochází k lepšímu využití přítomné vody, protože
- se redukuje vzdálenost otvorů stomat
 - vytvoří se tlustější epidermis a cuticula
 - zlepší se prokořenění půdy
 - kompaktnějším růstem se příznivě ovlivní mikroklima rostlinného porostu.

Účinné látky používané podle vynálezu se mohou kulturním rostlinám dodávat již prostřednictvím semen (jako mořidlo osiva), přes půdu, tj. kořeny jakož i postřikem přes listy.

V důsledku vysoké snášenlivosti rostlin s účinnými látkami může množství používané jako regulator růstu silně kolísat. Při ošetřování osiva se potřebuje množství účinné látky od 0,001 do 50 g na kilogram osiva, zejména 0,005 až 0,5 g. Pro ošetření listů a půdy jsou dávky 0,01 až 10 kg/ha, zejména 0,05 až 1 kg/ha.

Prostředky se mohou používat ve formě obvyklých přípravků, jako jsou roztoky, emulze, suspense, popraše, prášek, pasty a granuláty. Formy použití se zcela řídí účelem použití, mají v každém případě umožňovat jemné a stejnoměrné rozptýlení účinné látky. Přípravky se vyrábějí známým způsobem, například nastavením účinné látky rozpouštědlem a/nebo nosnými látkami, popřípadě za použití emulgačních prostředků a dispergačních prostředků, přičemž v případě použití vody jako zředovacího prostředku se mohou použít jiná organická rozpouštědla jako pomocné prostředky. Jako pomocné látky přicházejí hlavně v úvahu: Rozpouštědla jako aromaty (například xylen), chlorované aromáty (například chlorbenzeny), parafiny (například ropné frakce), alkoholy (například methanol, butanol), ketony (například cyklohexanon), aminy (například ethanolamin, dimethylformamid) a voda; nosné látky jako přírodní kamenné moučky (například kaolin, oxid hlinitý, mastek, křída) a syntetické kamenné moučky (například vysocedispersní kyselina křemičitá, silikáty); emulgační prostředky, jako neionogenní a anionické emulgátory (například polyoxyethylenether, ethery alifatických alkoholů, alkylsulfonáty a arylsulfonáty) a dispergační prostředky, jako ligninsulfitové odpadní louhy a methylcelulosa.

Fungicidní prostředky a růst regulující prostředky obsahují obvykle mezi 0,1 a 95, zejména mezi 0,5 a 90 % hmot. účinné látky.

Množství používané jako fungicidy jsou podle druhu požadovaného fungicidního účinku mezi 0,02 a 3 kg účinné látky nebo více na ha. Nové sloučeniny se také mohou používat jako materiálová ochrana (ochrana dřeva), například proti *Paecilomyces variotii*.

Prostředky, popřípadě z nich vyrobené a k použití hotové přípravky, jako roztoky, emulze, suspense, prášky, popraše, pasty nebo granuláty se používají známým způsobem, například postřikem, zamlžováním, poprašováním, rozptylováním, mořením nebo litím.

Příklady takových přípravků jsou:

- I. Smíchá se 90 hmot. dílů sloučeniny č. 1 s 10 hmot. díly N-methyl- α -pyrrolidonu a získá se roztok, který je vhodný k použití ve formě drobných kapek.
- II. 20 hmot. dílů sloučeniny č. 3 se rozpustí ve směsi, která sestává z 80 hmot. dílů xyleny, 10 hmot. dílů adičního produktu 8 až 10 mol ethylenoxidu a 1 mol N-monoethanolamidu kyseliny olejové, 5 hmot. dílů vápenaté sole kyseliny dodecylbenzensulfonové a 5 hmot. dílů adičního produktu 40 mol ethylenoxidu a 1 mol ricinového oleje. Jemným rozptýlením roztoku ve vodě se získá vodná disperse.
- III. 20 hmot. dílů sloučeniny č. 4 se rozpustí ve směsi sestávající z 40 hmot. dílů cyklohexanonu, 30 hmot. dílů isobutanolu, 20 hmot. dílů adičního produktu 40 mol ethylenoxidu a 1 mol ricinového oleje. Vlitím a jemným rozptýlením roztoku ve vodě se získá vodná disperse.
- IV. 20 hmot. dílů sloučeniny č. 5 se rozpustí ve směsi, která sestává z 25 hmot. dílů cyklohexanolu, 65 hmot. dílů frakce minerálního oleje o teplotě varu 210 až 280 °C a 10 hmot.

- dílů adičního produktu 40 mol ethylenoxidu a 1 mol ricinového oleje. Vlitím roztoku do vody a jemným rozptýlením se získá vodná disperse.
- V. 80 hmot. dílů sloučeniny č. 6 se dobře smíchá s 3 hmot. díly sodné sole kyseliny diisobutyl-naftalen- α -sulfonové, 10 hmot. díly sodné sole kyseliny ligninsulfonové ze sulfitového odpadního louhu a 7 hmot. díly práškového gelu kyseliny křemičité a v kladivovém mlýnu se rozemele. Jemným rozptýlením směsí ve vodě se získá stříkací břečka.
- VI. 3 hmot. díly sloučeniny č. 7 se dobře smíchá s 97 hmot. díly jemného kaolinu. Tímto způsobem se získá poprašový prostředek, který obsahuje 3 % hmot. účinné látky.
- VII. 30 hmot. dílů sloučeniny č. 9 se dobře smíchá se směsí z 92 hmot. dílů práškového gelu kyseliny křemičité a 8 hmot. dílů parafinového oleje, který byl nastříkán na povrch tohoto gelu kyseliny křemičité. Tímto způsobem se získá zpracování účinné látky s dobrou přilnavostí.
- VIII. 40 hmot. dílů sloučeniny č. 17 se dobře smíchá s 10 hmot. díly sodné sole kondensátu kyseliny fenolsulfonová-močovina-formaldehyd, 2 hmot. díly křemičitého gelu a 48 hmot. díly vody. Získá se stabilní vodná disperse. Zředěním vodou se obdrží vodná disperse.
- IX. 20 hmot. dílů sloučeniny č. 33 se dobře smíchá se 2 hmot. díly vápenaté sole kyseliny dodecylbenzensulfonové, 8 hmot. díly polyglykoetheru alifatického alkoholu, 2 hmot. díly sodné sole kondensátu kyseliny fenolsulfonová-močovina-formaldehyd a 68 hmot. díly parafinického minerálního oleje. Získá se stabilní olejová disperse.

V těchto formách použití mohou prostředky podle vynálezu také být používány spolu s jinými účinnými látkami, jako například s herbicidy, insekticidy, regulátory růstu a fungicidy nebo také s hnojivy. Při smíchání s fungicidy se při tom v mnoha případech obdrží zvětšení fungicidního spektra účinnosti.

Následující seznam fungicidů se kterými se mohou sloučeniny podle vynálezu kombinovat mají kombinační možnosti vysvětlit, ne však omezovat.

Fungicidy se kterými se sloučeniny mohou kombinovat jsou například:

Síra,
 Dithiokarbamaty a jejich deriváty, jako
 Ferridimethyldithiokarbamat,
 Zinkdimethyldithiokarbamat,
 Zinkethylenbisdithiokarbamat,
 Manganethylenbisdithiokarbamat,
 Mangan-zink-ethylendiamin-bis-dithiokarbamat,
 Tetramethylthiuramdisulfidy,
 Amoniakální komplex zink-(N,N-ethylen-bis-dithiokarbamatu),
 Amoniakální komplex zink-(N,N'-propylen-bis-dithiokarbamatu),
 Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiokarbamat),
 N,N'-Polypropylen-bis-(thiokarbamoyl)-disulfid;

Nitroderiváty, jako

Dinitro-(1-methylheptyl)-fenylkrotonat,
 2-sek. Butyl-4,6-dinitrofenyl-3,3-dimethylakrylát,
 2-sek. Butyl-4,6-dinitrofenyl-isopropylkarbonát;
 Di-isopropylester kyseliny 5-nitro-isoftalové,

Heterocyklické látky, jako

2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetát,
 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin,
 0,0-Diethyl-ftalimidofosfonothioat,
 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-fosfinyl]-3-fenyl-1,2,4-triazol,
 2,3-Dikyano-1,4-dithioantrachinon,
 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin,
 Methylester kyseliny 1-(butylkarbamoyl)-2-benzimidazolkarbaminové,
 2-Methoxykarbonylamino-benzimidazol,
 2-(Furyl-(2))-benzimidazol,
 2-(Furyl-(2))-benzimidazol,
 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol,
 N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydroftalimid,
 N-Trichlormethylthio-tetrahydroftalimid,
 N-Trichlormethylthio-ftalimid,

Diamid kyseliny N-dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-fenyl-sírové

5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol,
 2-Rhodanmethylthiobenzthiazol,
 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzen,
 4-(2-Chlorfenylhydroazano)-3-methyl-5-isoxazon,
 Pyridin-2-thio-1-oxid,
 8-Hydroxychinolin popřípadě jeho měďnatá sůl,
 2,3-Dihydro-5-karboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin,
 2,3-Dihydro-5-karboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid,
 Anilid kyseliny 2-methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-karboxylové,
 Anilid kyseliny 2-methyl-furan-3-karboxylové,
 Anilid kyseliny 2,5-dimethyl-furan-3-karboxylové,
 Anilid kyseliny 2,4,5-trimethyl-furan-3-karboxylové,
 Cyklohexylamid kyseliny 2,5-dimethyl-furan-3-karboxylové,
 Amid kyseliny N-cyklohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-karboxylové,
 Anilid kyseliny 2-methyl-benzoové,
 Anilid kyseliny 2-jod-benzoové,
 N-Formyl-N-morfolin-2,2,2-trichlorethylacetal,
 Piperazin-1,4-diylbis-(1-(2,2,2-trichlor-ethyl))-formamid,
 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan,
 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morfolin popřípadě jeho sole,
 2,6-Dimethyl-N-cyklododecyl-morfolin popřípadě jeho sole,
 N-[p-terc. Butylfenyl]-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethyl-morfolin,
 N-[p-terc. Butylfenyl]-2-methylpropyl]-piperidin,
 1-[2-(2,4-Dichlorfenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol,
 1-[2-(2,4-Dichlorfenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol,
 N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorfenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-močovina,
 1-(4-Chlorfenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon,

1-(4-Chlorfenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-
-2-butanol,
 α -(2-Chlorfenyl)- α -(4-chlorfenyl)-5-pyrimidin-methanol,
 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin,
 Bis-(p-chlorfenyl)-3-pyridinmethanol,
 1,2-Bis-(3-ethoxykarbonyl-2-thioureido)-benzen,
 1,2-Bis-(3-methoxykarbonyl-2-thioureido)-benzen,

jakož i různé fungicidy, jako

Dodecylguanidinacetát,
 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyklohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid,
 Hexachlorbenzen,
 DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-fenyl)-N-furoyl(2)-alaninat,
 DL-N-(2,6-dimethyl-fenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methylester,
 N-(2,6-Dimethylfenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolakton,
 DL-N-(2,6-Dimethylfenyl)-N-(fenylacetyl)-alaninmethylester,
 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorfenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxa-zolidin,
 3-[3,5-Dichlorfenyl-(5-methyl-5-methoxymethyl)]-1,3-oxazolidin-
 -2,4-dion,
 3-(3,5-Dichlorfenyl)-1-isopropylkarbamoylhydantoin,
 Imid kyseliny N-(3,5-Dichlorfenyl)-1,2-dimethylcyklopropan-1,2-
 -dikarboxylové,
 2-Kyano-[N-(ethylaminokarbonyl)-2-methoxyimino]-acetamid,
 1-[2-(2,4-Dichlorfenyl)-pentyl]-1H-1,2,4-triazol,
 2,4-Difluor- α -(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalkohol,
 N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-fenyl)-5-tri-
 fluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin,
 1-((bis-(4-Fluorfenyl)-methylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol.

Příklady použití

Jako srovnávací účinná látka byl použit 1-bis-(4-fluorfenyl)-
-methyl-1H-1,2,4-triazol (A) - známý z EP 165 777.

Příklad použití 1 (Účinek proti padlí na pšenici)

Listy pšeničných klíčků druhu "Kancler" vyrostlých v kořená-
cích byly postříkány vodnou stříkací břečkou, která obsahovala
80 % hmot. účinné látky a 20 % emulgátoru v sušině a 24 hodin po
zaschnutí postřiku byly poprášeny sporami padlí na pšenici
(*Erysiphe graminis* var. *tritici*). Pokusné rostliny potom byly
umístěny ve skleníku při teplotách mezi 20 a 22 °C a při 75% až
80% relativní vlhkosti vzduchu. Po 7 dnech byl zjišťován rozsah
vývoje padlí. Výsledky ukazují, že účinné látky 1, 3, 4, 5, 6,
7, 9, 17, 33, 108, 123, 124, 127, 128 a 129, při použití jako
0,006% (hmot. %) stříkací břečka ukazují lepší fungicidní účinek
(95 %) než známá srovnávací účinná látka A (75 %).

Příklad použití 2 (Účinek proti hnědé rzi na pšenici)

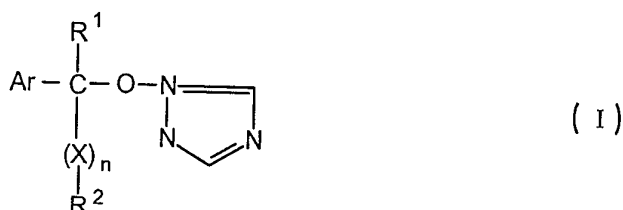
Listy pšeničných klíčků druhu "Kancler" vyrostlých v kořená-
cích byly poprášeny sporami hnědé rzi (*Puccinia recondita*). Potom
byly kořenáče na 24 hodin, při 20 až 22 °C umístěny v komoře
s vysokou vzdušnou vlhkostí (90 až 95 %). Během této doby spory
vyklíčily a trubičky klíčků se tlačily do listové tkáně. Infiko-
vané rostliny potom byly postříkány vodnými stříkacími břečkami,

které obsahovaly 80 % účinné látky a 20 % emulgátoru v sušině. Po zaschnutí postřiku byly pokusné rostliny umístěny ve skleníku při teplotách mezi 20 a 22 °C a při 65 až 70% relativní vlhkosti vzduchu. Po 8 dnech byl zjištěn rozsah vývoje hub rzi na listech.

Výsledek ukazuje, že účinné látky 1, 4, 7, 127 a 128 ukazují při použití jako 0,025% stříkací břečka lepší fungicidní účinek (95 %) než známá srovnávací účinná látka A (30 %).

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. 1,2,4-Triazolový derivát obecného vzorce I



ve kterém

Ar znamená fenylovou skupinu, která nese jeden nebo dva substituenty vybrané z atomu fluoru, atomu chloru a trifluor-methylové skupiny,

R¹ znamená atom vodíku nebo v případě, že n představuje číslo nulu, dále znamená kyanoskupinu,

R² znamená alkylovou skupinu se 2 až 5 atomy uhlíku,

2,2-dichlorvinyllovou skupinu,

fenylovou nebo 2-fenylethylovou skupinu, přičemž fenylový kruh v těchto skupinách může nést jeden nebo dva atomy fluoru nebo chloru, nebo

isoxazol-5-yllovou skupinu, která v poloze 3 nese substituent vybraný z alkylové skupiny se 3 nebo 4 atomy uhlíku, cyklopentylové skupiny nebo 4-terc.-butylfenylové skupiny,

X znamená atom síry nebo skupinu vzorce CH₂ a

n představuje číslo nula nebo 1.

2. Fungicidní prostředek, v y z n a č u j í c í s e t í m, že obsahuje pevnou nebo kapalnou nosnou látku a fungicidně účinné množství 1,2,4-triazolového derivátu obecného vzorce I podle nároku 1.

Konec dokumentu
