

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: 1995 - 2803

(22) Přihlášeno: 10.05.1994

(30) Právo přednosti:

12.05.1993 US 1993/060629

28.10.1993 US 1993/144904

(40) Zveřejněno: 13.03.1996

(Věstník č. 3/1996)

(47) Uděleno: 21.11.2002

(24) Oznámeno udělení ve Věstníku: 15.01.2003

(Věstník č. 1/2003)

(86) PCT číslo: PCT/US94/04965

(87) PCT číslo zveřejnění: WO 94/026722

(13) Druh dokumentu: B6

(51) Int. Cl. ⁷:

C 07 D 239/95

C 07 D 239/96

A 01 N 43/54

(73) Majitel patentu:

E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY,
Wilmington, DE, US;

(72) Původce vynálezu:

Bereznak James Francis, Aston, PA, US;
Chang Zen-Yu, Hockessin, DE, US;
Selby Thomas Paul, Wilmington, DE, US;
Sternberg Charlene Gross, Wilmington, DE, US;

(74) Zástupce:

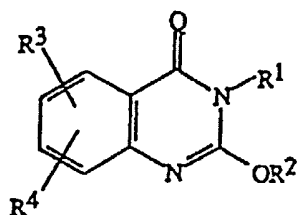
Čermák Karel Dr., Národní 32, Praha 1, 11000;

(54) Název vynálezu:

**Kondenzované bicyklické pyrimidinony,
fungicidní prostředek a způsob potlačování padlí
travního**

(57) Anotace:

Kondenzované bicyklické pyrimidinony obecného vzorce I,
kde Q představuje nezávisle atom kyslíku; R¹ je alkyl se 3 až
10 C, cykloalkyl se 3 až 5 C nebo cyklopropylmethyl; R² je
alkyl se 3 až 10 C nebo cykloalkyl se 6 až 7 C; R³ je halogen;
a R⁴ je H nebo halogen; přičemž když R¹ je
cyklopropylmethyl, potom R² je CH₂CH₂CH₃, R³ je 6-brom a
R⁴ je H. Fungicidní prostředek pro potlačování padlí travního
na pšenici obsahující sloučeninu vzorce I. Způsob potlačování
padlí travního na pšenici za použití sloučenin vzorce I.



(I)

Kondenzované bicycklické pyrimidinony, fungicidní prostředek a způsob potlačování padlí travního

5 Oblast techniky

Vynález se týká určitých kondenzovaných bicycklických pyrimidinonů, zejména 4(3H)-chinazolinonů a jejich zemědělsky vhodných solí. Tyto sloučeniny jsou fungicidy, a je možno jich použít zejména pro preventivní i kurativní potlačování padlí travního na obilninách. Dále se
 10 vynález týká také fungicidních prostředků na bázi výše uvedených sloučenin a způsobu potlačování padlí travního.

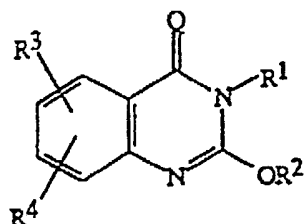
Dosavadní stav techniky

15 Určité 4-(3H)-chinazolinony, jakožto fungicidní činidla, jsou popsány v US 3 755 582 a US 3 867 384. V těchto patentech však nejsou konkrétně zveřejněny sloučeniny podle tohoto vynálezu.

20

Podstata vynálezu

Předmět vynálezu jsou kondenzované bicycklické pyrimidinony obecného vzorce I



(I),

25 kde

Q představuje atom kyslíku;

30 R¹ představuje alkylskupinu se 3 až 10 atomy uhlíku, cykloalkylskupinu se 3 až 5 atomy uhlíku nebo cyklopropylmethylskupinu;

R² představuje alkylskupinu se 3 až 10 atomy uhlíku nebo cykloalkylskupinu se 6 až 7 atomy uhlíku;

35 R³ představuje atom halogenu; a

R⁴ představuje atom vodíku nebo atom halogenu;

40 přičemž když R¹ představuje cyklopropylmethylskupinou, potom R² znamená skupinu vzorce CH₂CH₂CH₃, R³ představuje 6-brom a R⁴ představuje atom vodíku.

Ve výše uvedených definicích jednotlivých symbolů se pod označením „alkyl se 3 až 10 atomy uhlíku“, rozumí alkylová skupina s přímým nebo rozvětveným řetězcem, jako například n-propylskupina, izopropylskupina nebo různé izomery butylskupin, pentylskupin, hexylskupin atd.
 45 atd.

Pod označením „cykloalkyl“ se v závislosti na uvedené délce řetězce rozumí například cyklopropylskupina, cyklobutylskupina, cyklopentylskupina a cyklohexylskupina.

Pod označením „halogen“ se rozumí fluor, chlor, brom nebo jod.

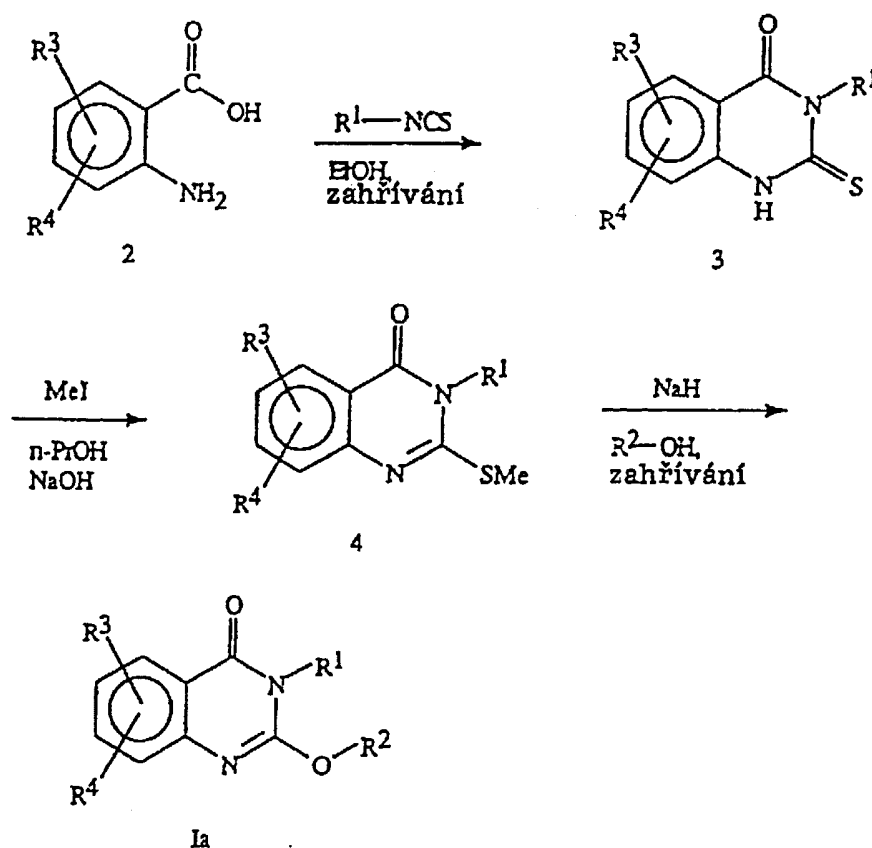
5

S ohledem na snadnost syntézy nebo výši fungicidního účinku se dává přednost určitým skupinám sloučenin, které jsou uvedeny dále. Výhodná provedení tohoto aspektu vynálezu tedy zahrnují tyto sloučeniny:

- 10 – sloučeniny obecného vzorce I, kde R^1 představuje alkylskupinu se 3 až 8 atomy uhlíku a R^2 představuje alkylskupinu se 3 až 8 atomy uhlíku;
 - 6-brom-3-propyl-2-propyloxy-4(3H)-chinazolinon,
 - 6-jod-3-propyl-2-propyloxy-4(3H)-chinazolinon,
 - 15 – 6-brom-3-(cyklopropylmethyl)-2-propyloxy-4(3H)-chinazolinon, a
 - 6,8-dijod-3-propyl-2-propyloxy-4(3H)-chinazolinon;
- sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje n-propylskupinu, n-decylskupinu, cyklopropylskupinu, n-butylskupinu, izopropylskupinu, cyklobutylskupinu, n-pentylskupinu, izobutylskupinu, cyklopentylskupinu, n-hexylskupinu nebo sek-butylskupinu, R^2 představuje n-propylskupinu, a buď R^4 představuje atom vodíku a R^3 představuje 6-brom nebo 6-jod, nebo R^4 představuje 8-jod a R^3 představuje 6-jod;
- 20 – sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje n-propylskupinu, R^2 představuje izobutylskupinu, n-decylskupinu, *tert*-butylskupinu, *sek*-butylskupinu, cyklohexylskupinu, izopropylskupinu, n-pentylskupinu, n-butylskupinu nebo n-hexylskupinu, a buď R^4 představuje atom vodíku a R^3 představuje 6-brom nebo 6-jod, nebo R^4 představuje 8-jod a R^3 představuje 6-jod;
- 25 – sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje atom kyslíku, R^1 a R^2 představuje vždy n-propylskupinu, a R^3 představuje 6-jod a R^4 představuje 8-brom nebo 8-jod R^3 představuje 6-chlor a R^4 představuje 8-chlor R^3 představuje 6-brom a R^4 představuje 8-chlor nebo 7-brom, nebo R^3 představuje 8-brom a R^4 představuje atom vodíku;
- 30 – sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $CH_2CH_2CH_3$, R^2 představuje $CH_2CH_2CH_3$, R^4 představuje atom vodíku a R^3 představuje 6-brom, 7-chlor, 5-chlor, 7-fluor, 6-fluor, 6-chlor nebo 6-jod;
- 35 – sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $CH_2CH_2CH_3$, R^3 představuje 6-brom, R^4 představuje atom vodíku a R^2 představuje $(CH)_3CH_3$, izopropylskupinu, $(CH_2)_4CH_3$, $(CH_2)_5CH_3$ nebo $CH_2CH_2C(CH_3)_3$;
- sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $CH_2CH_2CH_3$, R^2 představuje $CH_2CH_2CH_3$ a R^3 a R^4 představují 6-chlor a 8-chlor, 6-brom a 8-brom nebo 6-jod a 8-jod;
- 40 – sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $CH_2CH_2CH_3$, R^3 představuje 6-chlor, R^4 představuje atom vodíku a R^2 představuje izopropylskupinu nebo $(CH_2)_4CH_3$;
- 45 – sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $CH_2CH_2CH_3$, R^3 představuje 6-brom, R^4 představuje atom vodíku a R^2 představuje $CH_2CH_2CH_3$ nebo $(CH_2)_3CH_3$;
- 50 – sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $(CH_2)_3CH_3$, R^3 představuje 6-brom, R^4 představuje atom vodíku a R^2 představuje $CH_2CH_2CH_3$ nebo $(CH_2)_3CH_3$;

- sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^3 představuje 6-jod, R^4 představuje atom vodíku a R^2 představuje $(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$ nebo $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$;
- 5 – sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje atom kyslíku, R^2 představuje $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, R^3 představuje 6-brom, R^4 představuje atom vodíku a R^1 představuje $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, (cyklopropyl) CH_2 nebo $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{ethyl}$; (11) ze sloučenin, kde Q představuje atom kyslíku, R^1 a R^2 představuje vždy $(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$, R^3 představuje 6-brom a R^4 představuje atom vodíku a
- 10 – sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$, R^3 představuje 6-jod, R^4 představuje atom vodíku a R^2 představuje $(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$ nebo $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$.
- 15 Do rozsahu výše definovaných sloučenin spadají všechny možné stereoizomery. Různé stereoizomery zahrnující enantiomery, diastereomery a geometrické izomery. Odborníkům v tomto oboru je zřejmé, že některý stereoizomer může být účinnější než jiné stereoizomery. Pro oddělování účinnějšího stereoizomeru je možno použít o sobě známých způsobů. Do rozsahu tohoto vynálezu tedy spadají směsi, jednoduché stereoizomery a opticky aktivní směsi sloučenin
- 20 obecného vzorce I, jakož i jejich zemědělsky vhodných solí.
- Sloučeniny obecného vzorce I je možno vyrábět způsoby uvedenými dále ve schématech 1 až 2 a příklad provedení. V těchto schématech jsou sloučeniny obecného vzorce I znázorněny s atomem kyslíku ve významu Q, jakožto sloučeniny vzorce Ia.
- 25 kyselina anthranilová (kyselina 2-aminobenzoová) obecného vzorce 2 se kondenzuje s izothio-
 kyanátem obecného vzorce $R^1\text{-NCS}$, přičemž vznikne 2-thiochinazolindion obecného vzorce 3. Tato kondenzace se přednostně provádí za přítomnosti báze, jako je triethylamin. S-Methylací této sloučeniny se získá 2-methylthio-4(3H)chinazolinon obecného vzorce 4.
- 30 Pro zavedení skupiny $R^2\text{O}$ se na 2-methylthio-4(3H)chinazolinon obecného vzorce 4 působí směsí báze, například natriumhydridu a rozpouštědla vzorce $R^2\text{OH}$. Reakční směs se míchá po dobu 1 až 120 hodin při teplotě v rozmezí od 0 do 120 °C. Požadovaný 2- $R^2\text{O}$ -4(3H)-chinazolinon se může izolovat z reakční směsi extrakcí do rozpouštědla, které je nemísitelné
- 35 s vodou a potom se může přechistit chromatografií nebo překrystalováním. Podobné syntetické postupy jsou popsány v US patentu č. 3 755 582.

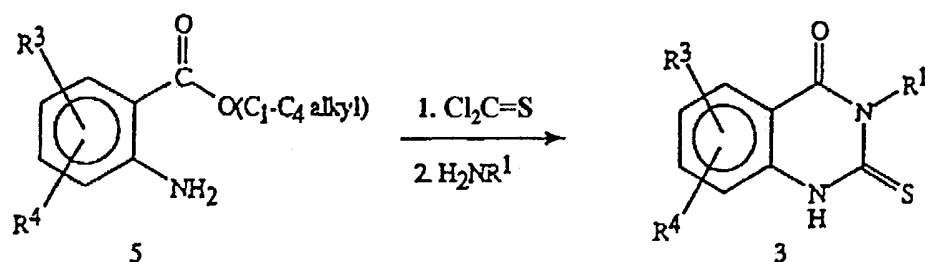
Schéma 1



5 Substituované kyseliny anthranilové obecného vzorce 2 jsou známé nebo je lze vyrobit známými postupy (viz například March J., *Advanced Organic Chemistry*, 3. vydání, John Wiley & Sons, New York (1985) str. 983). Izothiokyanáty vzorce R^1NCS je možno vyrobit z odpovídajících aminů působením thiofosgenem. Tento způsob je známý v oboru chemických syntéz (viz například J. *Heterocycl. Chem.* 1990, 27, 407).

10 Alternativně se mohou 2-thiochinazolindiony obecného vzorce 3 vyrobit reakcí alkylesteru kyseliny anthranilové s 1 až 4 atomy v alkylovém zbytku obecného vzorce 5 s thiofosgenem. Na vzniklý izothiokyanátester se potom působí aminem obecného vzorce R^1NH_2 (viz schéma 2).

Schéma 2



15

Ester anthranilové kyseliny vzorce 5 se nechá reagovat s thiofosgenem při teplotě v rozmezí od asi -20 do asi 100°C popřípadě v inertním rozpouštědle po dobu 1 až 48 hodin. Tato reakce se

často provádí ve doufázové směsi za přítomnosti báze, jako je uhličitán vápenatý, a kyseliny, jako je vodná kyselina chlorovodíková. Výsledný izothiokyanát se může izolovat extrakcí do rozpouštědla nemísitelného s vodou, jako je dichlormethan, přičemž organický extrakt se vysuší a odpaří za sníženého tlaku. Alternativně se může izothiokyanát in situ smíchat s aminem vzorce H_2NR^1 , přičemž vzniklá směs se 0,1 až 24 hodin míchá při teplotě od asi -20 do asi $50^\circ C$. Požadovaný 2-thiochinazolindion vzorce 3 se může izolovat z reakční směsi vodnou extrakcí. Produkt se může přečistit chromatografií nebo překrystalováním. Podobné syntetické postupy jsou popsány v J. Heterocycl. Chem. (1990), 27, 407.

Kromě způsobu popsaného výše je pro výrobu sloučenin obecného vzorce Ia možno použít vytěsnění chloru v poloze 2 z odpovídajících 4(3H)-chinazolinonů místo vytěsnění 2-methylthioskupiny (schéma 1).

Některá reakční činidla a reakční podmínky, které jsou popsány dále v souvislosti s přípravou sloučenin obecného vzorce I, nemusí být kompatibilní s některými významy symbolů R^1 až R^4 a Q. V těchto případech bude nutno pro získání požadovaných produktů zahrnout do syntetického postupu stupně chránění funkčních skupin a odstraňování chránicích skupin. Případy, v nichž je zapotřebí používat chránicích skupin a volba vhodných chránicích skupin, jsou zřejmě odborníkům v oboru chemické syntézy. Vhodné chránicí skupiny jsou například uvedeny v publikaci Greene T. W. a Wuts, P. G. M.: Protective Groups in Organic Synthesis, 2. vydání, John Wiley & Sons, Inc., New York (1980).

Soli sloučenin obecného vzorce I je možno vyrobit tak, že se na volnou bázi odpovídající sloučeniny působí silnou kyselinou, jako je kyselina chlorovodíková nebo kyselina sírová. Soli je také možno vyrobit alkylací terciární aminoskupiny v molekule za vzniku například trialkylamoniové soli.

Předmětem vynálezu je dále fungicidní prostředek pro potlačování padlí travního na pšenici, jehož podstata spočívá v tom, že obsahuje účinné množství kondenzovaného bicycklického pyrimidinonu definovaného výše, samotného nebo v kombinaci s jinou sloučeninou potlačující padlí travní na pšenici, ale s odlišným způsobem působení, a alespoň jednu složku zvolenou ze souboru sestávající z a) povrchově aktivní látky, b) organického rozpouštědla a c) alespoň jednoho pevného nebo kapalného ředidla.

Konečně je předmětem vynálezu také způsob potlačování padlí travního na pšenici, při němž se účinné množství kondenzovaného bicycklického pyrimidinonu definovaného výše, samotného nebo v kombinaci s jinou sloučeninou potlačující padlí travní na pšenici, ale s odlišným způsobem působení, aplikuje na rostliny nebo na části rostlin, které mají být chráněny, nebo na média, v nichž chráněné rostliny rostou nebo na semena nebo na semenáčky chráněných rostlin.

Vynález je blíže objasněn v následujících příkladech provedení. Tyto příklady mají výhradně ilustrativní charakter a rozsah vynálezu v žádném ohledu neomezuje.

Příklady provedení vynálezu

Příklad

5

Syntéza 6-brom-3-propyl-2-propyloxy-4(3H)-chinazolinonu

Všechny reakce se provádějí pod atmosférou dusíku.

10 Stupeň A

K roztoku 37 g 2-amino-5-brombenzoové kyseliny ve 200 ml ethanolu se za míchání po kapkách přidá 17,72 ml n-propylizothiokyanátu. Směs se 8 hodin zahřívá ke zpětnému toku, nechá zchladnout na teplotu místnosti a míchá se 60 hodin. Poté se směs ochladí asi na 5 °C

15 a odfiltruje se z ní 15,42 g špinavě bílé pevné látky.

Stupeň B

K roztoku 15,4 g produktu ze stupně A ve 100 ml 10% propanolického roztoku hydroxidu sodného se za míchání přidá 3,2 ml jodmethanu. Směs se míchá 10 minut při teplotě místnosti, poté zahřívá 1,5 hodiny ke zpětnému toku, nechá zchladnout na teplotu místnosti a míchá přes noc. Reakční směs se přefiltruje, čímž se získá 11,47 g bílé pevné látky. Tato bílá pevná látka se přečistí sloupcovou chromatografií na silikagelu za použití hexanu a poté směsí hexanu a ethylacetátu v poměru 9 : 1, jako mobilní fáze. Frakce obsahující nejméně polární produkt

25 (podle chromatografie na tenké vrstvě za použití směsí hexanu a ethylacetátu 6 : 1 jako vyvíjecího rozpouštědla) se spojí a odpaří. Získá se 6,55 g bílé pevné látky o teplotě tání 97 až 99 °C.

Stupeň C

30

Ke 150 ml propanolu ochlazenému asi na -60 °C se přidá 0,83 g natriumhydridu (60% disperze v oleji). K této směsi se přidá -60 °C přidá 6,5 g přečištěného produktu ze stupně B. Směs se nechá ohřát na teplotu místnosti a aby se získal čirý roztok, míchá se asi 48 hodin. Reakční roztok se nalije do vody a směs se extrahuje dvakrát diethyletherem. Etherové extrakty se promyjí dvakrát vodou, vysuší síranem hořečnatým a přefiltrují. Filtrát se odpaří, čímž se získá

35 10,3 g oleje. Chromatografie na tenké vrstvě ukáže, že v oleji je přítomna jak výchozí látka, tak požadovaný produkt.

Stupeň D

40

K propanolu ochlazenému na -50 °C se za míchání přidá 0,60 g natriumhydridu (60% disperze v oleji). K této směsi se při -40 °C přidá produkt ze stupně C a směs se nechá ohřát na teplotu místnosti a míchá asi 72 hodin. Směs se poté 30 minut zahřívá ke zpětnému toku, ochladí na teplotu místnosti, nalije do vody a extrahuje dvakrát diethyletherem. Spojené etherové extrakty se promyjí třikrát vodou, vysuší síranem hořečnatým a přefiltrují. Filtrát se odpaří na olej. Olej se přečistí sloupcovou chromatografií na silikagelu za použití nejprve hexanu a poté směsí hexanu a ethylacetátu v poměru 9 : 1 jako mobilní báze. Frakce obsahující pouze nejméně polární produkt (podle chromatografie na tenké vrstvě silikagelu za použití směsí hexanu a ethylacetátu v poměru 9 : 1 jako vyvíjecího rozpouštědla), se spojí a odpaří. Získá se 4,46 g sloučeniny

50 uvedené v nadpise ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 57 až 59 °C.

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): δ 8,3 (s, 1H), 7,7 (m, 1H), 7,3 (m, 1H), 4,43 (t, 2H), 4,05 (t, 2H), 1,85 (m, 2H), 1,7 (m, 2H), 1,06 (t, 3H), 0,97 (t, 3H).

Analogickým způsobem se mohou připravit i ostatní sloučeniny obecného vzorce I (viz tabulka A uvedenou dále).

Prostředky a použití

5 Sloučeniny podle vynálezu se bude obvykle používat ve formě fungicidních prostředků vhodných pro zemědělskou aplikaci. Tyto fungicidní prostředky, které rovněž spadají do rozsahu tohoto vynálezu, obsahující účinné množství alespoň jedné sloučeniny obecného vzorce I definované výše a alespoň jednu složku zvolenou ze souboru zahrnujícího a) povrchově aktivní látku, b) 10 organické rozpouštědlo a c) alespoň jedno pevné nebo kapalné ředidlo. Vhodné prostředky se mohou vyrábět obvyklými způsoby. Jako příklady vhodných prostředků je možno uvést popraše, granuláty, pelety, roztoky, suspenze, emulze, smáčitelné prášky, emulgovatelné koncentráty, práškovité tekuté koncentráty apod. Rozstřikovatelné prostředky je možno ředit vhodnými médii a aplikovat při objemu postřiku v rozmezí od asi 1 do několika stovek litrů na hektar. Vysoce 15 koncentrovaných prostředků se používá především jako meziproduktů pro výrobu zředěnějších prostředků. Výše uvedené prostředky budou obvykle obsahovat účinné množství účinné přísady, ředidlo a povrchově aktivní látku v množstvích spadajících do dále uvedených přibližných rozmezí, přičemž hodnota 100 % odpovídá celému prostředku.

	Účinná přísada	% hmotnostní	
		Ředidlo	Povrchově aktivní látka
Smáčitelné prášky	5 až 90	0 až 74	1 až 10
Olejovité suspenze, emulze, roztoky (včetně emulgovatelných koncentrátů)	5 až 50	40 až 95	0 až 15
Popraše	1 až 25	70 až 99	0 až 5
Granule a pelety	0,01 až 99	5 až 99,99	0 až 15
Koncentráty	90 až 99	0 až 10	0 až 2

20 Typická pevná ředidla jsou popsána v publikaci Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2. vydání, Dorland Books, Caldwell, New Jersey, USA. Typická kapalná ředidla a rozpouštědla jsou popsána v publikaci Marsden, Solvents Guide, 2. vydání, Interscience, New York (1950), USA. Seznam vhodných povrchově aktivních látek a doporučené 25 způsoby jejich použití jsou uvedeny v publikaci McCutcheons's Detergents and Emulsifiers Annual, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey, jakož i v publikaci Sisely a Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co. Inc., New York (1964), USA. Všechny prostředky mohou dále obsahovat menší množství přísad pro snížení tvorby pěny, spékání, koroze, růstu mikroorganismů apod.

30 Prostředky podle vynálezu se mohou vyrábět o sobě známými postupy. Roztoky se vyrábějí jednoduchým smícháním složek. Pevné prostředky ve formě jemných částic se vyrábějí mísením a zpravidla rozmělněním v kladivovém mlýnu nebo ve fluidním mlýnu. Granule dispergovatelné ve vodě je možno vyrobit aglomerací jemného práškovitého prostředku (viz například 35 Cross et al., Pesticide Formulations, Washington, D.C., (1988), str. 251 – 259). Suspenze je možno vyrábět mletím za mokra (viz například US 3 060 084). Granule a pelety je možno vyrábět nástřikem účinné přísady na předem vyrobené granulární nosiče nebo aglomeračními technologiemi (viz Browning „Agglomeration“, Chemical Engineering, 4. prosince 1967, str. 147 až 148, Perry's chemical Engineer's Handbook, 4. vydání, McGraw-Hill, New York (1963), str. 8 40 až 57 a dále a WO 91/13546). Pelety je možno vyrábět způsobem popsaným v US 4 172 714. Granule dispergovatelné nebo rozpustné ve vodě je možno vyrábět způsobem popsaným v DE 246 493. Další informace týkající se výroby prostředků je možno nalézt v US 3 235 361, sloupec 6, řádek 16 až sloupec 7, řádek 19 a příklad 10 až 41; US 3 309 192, sloupec 5, řádek 43 až sloupec 7 řádek 62 a příklady 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138 až 140, 162 až 164, 166, 45 167 až 169 až 182; US 2 891 855, sloupec 3 řádek 66 až sloupec 5 řádek 17 a příklad 1 až 4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons Inc., New York (1961), str. 88 až 96

a Hance et al., Weed Control Handbook, 8. vydání, Blackwell Scientific Publications, Oxford (1989).

- 5 Všechny prostředky uvedené v následujících příkladech se vyrábějí běžnými postupy a procentní údaje jsou hmotnostní. Pod označením „sloučenina 1“ se rozumí sloučenina uvedená v tabulce A (dále).

10 Příklad A

Smáčitelný prášek

	Sloučenina 1	65,0 %
	Dodecylfenolpolyethylenglykolether	2,0 %
15	Ligninsulfonát sodný	4,0 %
	Silikoaluminát sodný	6,0 %
	Montmorillonit (kalcinovaný)	23,0 %

20 Příklad B

Granule

	Sloučenina 37	10,0 %
25	Granule attapulgitu (nízký obsah těkavých látek, 0,71/0,30 mm; síto 25 až 50 ze sady sít podle normy ASTM	90,0 %

30 Příklad C

Extrudované pelety

	Sloučenina 25	25,0 %
35	Bezvodý síran sodný	10,0 %
	Surový ligninsulfonát vápenatý	5,0 %
	Alkyl-naftalensulfonát sodný	1,0 %
	Bentonit vápenatý/horečnatý	59,0 %

40

Příklad D

Emulgovatelný koncentrát

45	Sloučenina 37	20,0 %
	Směs olejorozpuštěných sulfonátů a polyoxyethyletherů	10,0 %
	Izoforon	70,0 %

- 50 Jak již bylo uvedeno výše, jsou sloučeniny podle vynálezu užitečné jako činidla pro potlačování chorob rostlin, zejména pro potlačování padlí travního obilnin (například *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, což je původce padlí travního na pšenici). Obecně však sloučeniny a prostředky podle vynálezu zajišťují potlačení chorob vyvolaných širokým spektrem fungálních patogenů rostlin z tříd Basidiomycete, Ascomycete, Oomycete a Deuteromycete. Jsou účinné při
- 55 potlačování širokého spektra rostlinných chorob, zejména foliárních patogenů na okrasných

rostlinách, zeleně, polních plodinách, obilninách a ovoci. Tyto patogeny zahrnují *Plasmopara viticola*, *Phytophthora infestans*, *Peronospora tabacina*, *Pseudoperonospora cubensis*, *Pythium aphanidermatum*, *Alternaria brassicae*, *Septoria nodorum*, *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Cercospora beticola*, *Botrytis cinerea*, *Monilinia Fructicola*, *Pyricularia oryzae*, *Podosphaera leucotricha*, *Venturia inaequalis*, *Erysiphe graminis*, *Uncinula necator*, *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis*, *Hemileia vastatrix*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia arachidis*, *Rhizoctonia solani*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Fusaria oxysporum*, *Verticillium dahliae*, *Pythium aphanidermatum*, *Phytophthora megasperma* a jiné rody a druhy, které jsou blízké těmto patogenům.

Sloučeniny podle vynálezu jsou také možno mísit s jedním nebo více dalšími insekticidy, fungicidy, nematocidy, baktericidy, akaricidy, semiochemikáliemi, repelenty, atraktanty, feromony, stimulatory krmení a jinými biologicky účinnými sloučeninami, za vzniku více-složkových pesticidů poskytujících ještě širší spektrum zemědělské ochrany. Jako příklady jiných zemědělských chránících činidel, s nimiž je možno sloučeniny podle vynálezu kombinovat, je možno uvést: insekticidy, jako acephate, avermectin B, izanphosmethyl, bifenthrin, biphenae, buprofezin, carbofuran, chlordimeform, chlorpyrifos, cyfluthrin, deltamethrin, diazinon, diflubenzuron, dimethoate, esfenvalerate, fenpropathrin, fenvalerate, fipronil, flucithrin, flufenprox, fluvalinate, fonophos, izofenphos, malathion, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methomyl, methoprene, methoxychlor, monocrotophos, oxamyl parathion-methyl, permethrin, phorae, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, prefenofos, rotenone, sulprofos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiodikarb, tralomethrin, trichlorfon a triflumuron; fungicidy, jako benomyl, blastidion S, bromuconazole, captafol, captan, carbedazim, chloronab, chlorothalonil, oxychlorid mědi, soli mědi, cymoxanil, cyproconazole, cyrodinil, dichloran, diclobutrazol, diclomezine, difenoconazole, diniconazole, dodime, edifenphos, epoxyconazole, fenarimol, fenbuconazole, fenpropidine, fenpropimorph, fluquincovazole, flusilazol, flutolanil, flutriafol, folpet, furalaxyl, hexaconazole, ipconazole, iprobenfos, inprodione, izoprothiolane, kasugamycin, mancozeb, maneb, mepronil, metalaxyl, metconazole, miclobutamyl, neo-asozin, oxadixyl, penconazole, pencycuron, phosetyl-A1, probenazole, prochloraz, propiconazole, pyrifenoxy, pyrimethanil, pyroquilon, síra, tebuconazole, tetraconazole, thiabendazole, thiophanate-methyl, thiuram, triadimefon, triadimenon, tricyclazole, triticonazole, uniconazole, validamycin a vinclozolin; nematocidy, jako aldoxycarb, fenamiphos a fosthietan; baktericidy, jako oxytetracycline, streptomycin a tribázický síran mědi; akaricidy, jako amitraz, binapacryl, chlorobenzilate, cyhexatin, dicofol, dienochlor, fenbutatin oxide, hexythiazox, oxythioquinox, propargite a tebufenpyrad; a biologická činidla, jako je *Bacillus thuringiensis* a baculovirus.

Pro zvládnutí rezistence bude v některých případech obzvláště výhodné používat kombinaci s jinými fungicidy s podobným spektrem účinnosti, ale odlišným mechanismem působení. Jako přednostní kombinace tohoto typu je možno uvést kombinace sloučenin obecného vzorce I s fungicidem zvoleným ze souboru zahrnujícího flusilazole, cyproconazole, tetraconazole, fenpropimorph, fenpropidine, cymoxanil, benomyl, carbendazim, mancozeb a maneb.

Potlačování chorob rostlin se obvykle provádí tak, že se účinné množství sloučeniny podle vynálezu aplikuje před, nebo po infekci, na části rostlin, které mají být chráněny, jako jsou kořeny, lodyhy, listy, plody, semena, hlízy nebo cibule, nebo na média (půdu nebo písek), v nichž chráněné rostliny rostou. Sloučeniny lze také aplikovat na osivo, a v tomto případě se chrání samotné osivo nebo semenáčky.

Intenzita aplikace sloučenin podle vynálezu může být ovlivněna mnoha faktory prostředí a je třeba ji stanovit s ohledem na skutečné podmínky při aplikaci. Pro ochranu listů se obvykle sloučeniny podle vynálezu aplikují v množství od méně než 1 g/ha do 5000 g/ha, počítáno jako účinná složka. Pro ochranu osiva a semenáček se obvykle používá 0,1 až 10 g/kg, vztaženo na osivo, účinné přísady.

Potlačovací účinnost sloučenin podle vynálezu na specifické patogeny je demonstrována v následujících zkouškách. Možnost potlačení patogenů sloučeninami podle vynálezu však není omezena na konkrétní patogeny, kterých bylo při těchto zkouškách použito. Popis použitých sloučenin je uveden v tabulce A. Zkoušky se provádějí takto:

5

Zkoušená sloučenina se nejprve rozpustí v acetonu v množství ekvivalentním 3% koncentraci v konečném objemu prostředku. Vzniklý roztok se potom zředí purifikovanou vodou obsahující 250 ppm povrchově aktivní látky Trem^(R) 014 (estery vícemocného alkoholu) na koncentraci 200 ppm. Vzniklé suspenze se potom použije při zkouškách.

10

Zkouška A

Zkoušená suspenze se nastříká na semenáčky pšenice v množství až do kapu. Následující den se semenáčky inokulují práškovitými sporami *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* (patogen vyvolávající padlí travní na pšenici) a inkubují se v růstové komoře 7 dnů při 20 °C. Potom se provede klasifikace choroby.

15

Zkouška B

Zkoušená suspenze se nastříká na semenáčky pšenice v množství až do okapu. Následující den se semenáčky inokulují suspenzí spor *Puccinia recondita* (patogen vyvolávající rez na listech pšenice) a inkubují se v nasycené atmosféře při teplotě 20 °C po dobu 24 hodin. Potom se semenáčky přenesou na dnů do růstové komory, v níž se udržuje teplota 20 °C a provede se klasifikace choroby.

20

Zkouška C

Zkoušená suspenze se nastříká na semenáčky rajčete v množství až do okapu. Následující den se semenáčky inokulují suspenzí spor *Phytophthora infestans* (patogen vyvolávající plíseň na bramborech a rajčatech) a inkubují se v nasycené atmosféře při teplotě 20 °C po dobu 24 hodin. Potom se semenáčky přenesou na 5 dnů do růstové komory, v níž se udržuje teplota 20 °C a provede se klasifikace choroby.

25

Zkouška D

Zkoušená suspenze se nastříká na semenáčky vinné révy v množství až do okapu. Následující den se semenáčky inokulují suspenzí spor *Phasmopara viticola* (patogen vyvolávající plíseň na rostlinách vinné révy) a inkubují se v nasycené atmosféře při teplotě 20 °C po dobu 24 hodin. Potom se semenáčky přenesou na 6 dnů do růstové komory, v níž se udržuje teplota 20 °C. Potom se semenáčky znovu inkubují v nasycené atmosféře 24 hodin při 20 °C a provede se klasifikace choroby.

30

35

Zkouška E

Zkoušená suspenze se nastříká na semenáčky okurky v množství až do okapu. Následující den se semenáčky inokulují suspenzí spor *Botrytis cinerea* (patogen vyvolávající plíseň šedou na mnoha plodinách) a inkubují se v nasycené atmosféře při teplotě 20 °C po dobu 48 hodin. Potom se semenáčky přenesou na 5 dnů do růstové komory, v níž se udržuje teplota 20 °C a provede se klasifikace choroby.

40

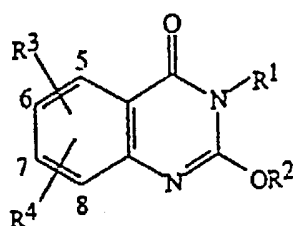
45

V následujících tabulkách symbol ^a znamená, že údaje ¹H NMR pro příslušnou sloučeninu ve formě oleje jsou uvedeny v tabulce B, Me znamená methyl, Ph znamená fenyl a Pr znamená propyl

50

55

Tabulka A



(Ia)

Sloučeniny obecného vzorce Ia:

Sloučenina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	t.t. ^a (°C)
1	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Br	H	57-59
2	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	7-Cl	H	57-60
3	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	5-Cl	H	69-75
4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	8-Me	H	47-49
5	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	5-Me	H	Olej
6	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Me	H	47-50
7	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-OMe	7-OMe	112-114
8	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	7-F	H	olej
9	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	7-NO ₂	H	64-66
10	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-OMe	H	49-52
11	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Me	8-Me	81-84
12	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-C≡CH	H	105-107
13	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-F	H	60-62
14	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Cl	H	64-66
15	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ =CH ₂	6-Cl	H	78-80
16	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ =CH ₂	B-Br	H	73-75
17	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Cl	8-Cl	78-80
18	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Br	8-Br	89-94
22	CH ₂ CH ₂ CH ₃	(CH ₂) ₃ CH ₃	6-Br	H	58-59
23	CH ₂ CH ₂ CH ₃	i-Pr	6-Br	H	45-46
25	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-I	H	48-49
26	CH ₂ CH ₂ CH ₃	(CH ₂) ₅ CH ₃	6-Br	H	56-57
27	CH ₂ CH ₂ CH ₃	(CH ₂) ₅ CH ₃	6-Br	H	olej
28	CH ₂ CH ₂ CH ₃	i-Pr	6-Cl	H	48-49
29	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Br	H	56-58
30	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	6-Cl	H	olej
31	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	6-Br	H	70-72
32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	(CH ₂) ₃ CH ₂ SCH ₃	6-Br	H	86-91
33	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	6-Br	H	olej
34	CH ₂ CH ₂ CH ₃	(CH ₂) ₄ CH ₃	6-Cl	H	olej
35	CH ₂ CH ₂ CH ₃	(CH ₂) ₄ CH ₃	6-I	H	47-49
36	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	6-I	H	43-46
37	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-I	8-I	135-138
38	(CH ₂) ₃ CH ₃	(CH ₂) ₃ CH ₃	6-Br	H	olej
39	CH ₂ CH ₂ CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₂ Ph	6-Br	H	72-74
40	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	6-Br	H	55-57
41	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	6-Br	H	39-42
42	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂ HCl	6-Br	H	215-230
43	(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Br	H	olej
44	(CH ₂) ₃ OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Br	H	61-64

Tabulka A - pokračování

Sloučenina č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	t.t. ^a (°C)
45	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Br	H	50-55
46	(c-propyl)CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Br	H	99-101
47	CH(CH ₂)Et	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Br	H	olej
48	(CH ₂) ₄ CH ₃	(CH ₂) ₄ CH ₃	6-Br	H	olej
49	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-NO ₂	H	68-75
50	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-C≡C-SiMe ₃	H	76-78
51	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-I	H	54-57
52	(CH ₂) ₃ CH ₃	(CH ₂) ₃ CH ₃	6-I	H	50-51
53	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-I	H	50-52
54	(CH ₂) ₃ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Br	H	69-71
55	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N ⁺ (CH ₃) ₃ I ⁻	6-Br	H	223-225
56	(CH ₂) ₃ N ⁺ (CH ₃) ₃ I ⁻	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Br	H	200-204
57	(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂ HCl	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Br	H	145-150
58	CH ₂ CHBrCH ₂ Br	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Br	H	118-121
59	CH ₂ CH ₂ (N-1,4-morfolinyl)	CH ₂ CH ₂ CH ₃	6-Br	H	103-105
77	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	6-Br	H	104-106
79	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	6-Br	H	72-75
80	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Ph	6-I	8-I	159-162

5

Tabulka B

Sloučenina číslo	Údaje ¹ H NMR ^b
5	7,46 (dd, 1H), 7,29 (d, 1H), 7,04 (d, 1H), 4,42 (t, 2H), 4,02 (m, 2H), 2,84 (s, 3H), 1,85 (m, 2H), 1,71 (m, 2H), 1,06 (t, 3H), 0,98 (t, 3H).
8	8,17 (dd, 1H), 7,09 (dd, 1H), 7,00 (dt, 1H), 4,42 (t, 2H), 4,05 (m, 2H), 1,85 (m, 2H), 1,73 (m, 2H), 1,07 (t, 3H), 0,97 (t, 3H).
27	0,93-0,99 (2t, 6H), 1,37 (m, 4H), 1,48 (m, 2H), 1,75 (m, 2H), 1,80 (m, 2H), 4,05 (t, 2H), 4,46 (t, 2H), 7,34 (d, 1H), 7,70 (d, 1H), 8,30 (s, 1H).
30	0,94-0,98 (t, 3H), 1,70 (m, 2H), 2,59 (m, 2H), 4,02 (t, 2H), 4,53 (t, 2H), 5,19 (dd, 2H), 5,90 (m, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,59 (d, 1H), 8,12 (s, 1H).
33	0,93-0,98 (t, 3H), 1,70 (m, 2H), 2,60 (q, 2H), 4,03 (t, 2H), 4,51 - 4,55 (t, 2H), 5,20 (dd, 2H), 8,29, 8,30 (m, 1H).
34	0,95-0,99 (m, 6H), 1,41 (m, 4H), 1,70 (m, 2H), 1,81 (m, 2H), 4,05 (t, 2H), 4,44-4,48 (t, 2H), 7,40 (d, 1H), 7,58 (d, 1H), 8,13 (s, 1H).
38	0,94-1,03 (2-t, 6H), 1,40 (m, 2H), 1,48 (m, 2H), 1,65 (m, 2H), 1,80 (m, 2H), 4,10 (t, 2H), 4,47 (t, 2H), 7,34 (d, 1H), 7,70 (d, 1H), 8,29 (s, 1H).
43	2,22 (s, 6H), 7,33 (d, 1H), 7,71 (d, 1H), 8,30 (s, 1H).
47	1,45 (d, 3H), 7,30 (d, 1H), 7,68 (d, 1H), 8,29 (s, 1H).
48	7,31 (d, 1H), 7,69 (d, 1H), 8,30 (s, 1H).

^b pokud není uvedeno jinak. ¹H NMR spektra byla získána v CDCl₃ na 400MHz spektrometru. Data jsou uvedena v ppm směrem dolů od tetramethylsilanu s = singlet, d = dublet, t = triplet, m = multiplet, dd = dublet dubletů, dt = dublet tripletů

Výsledky zkoušky A až E jsou uvedeny v tabulce 13. Stupeň 100 odpovídá 100% potlačení a stupeň 0 odpovídá žádnému potlačení choroby (vzhledem ke kontrole). Symbol „-“, znamená „nezkoušeno“.

Tabulka 13

Sloučenina číslo	Zk. A ¹	Zk. B	Zk. C	Zk. D	Zk. E
1	100	4	24	58	0
2	75	7	0	18	0
3	72	59	0	92	0
4	41	3	0	26	0
5	54	0	23	50	0
6	45	0	0	0	81
7	7	57	23	50	0
8	14	3	0	26	0
9	96	0	0	39	0
10	40	0	0	17	67
12	100	0	0	91	83
13	95 ²	0	0	0	0
14	100	0	0	41	45
15	99 ³	0	0	41	4
16	100 ³	0	0	41	0
17	99 ³	0	33	0	0
18	100 ³	20	20	0	32
22	100	0	0	41	0
23	97	46	0	0	0
25	100 ³	46	0	8	0
26	—	4 ¹	0	6	0
27	100	7	0	18	0
29	97	46	0	0	0
30	100 ³	3	0	26	0
31	38	3	0	26	0
32	100 ³	3	0	26	0
33	100	3	0	81	0
34	100 ³	3	0	68	0
35	100 ³	0	0	0	0
36	100 ³	3	0	50	0
37	100 ³	93	26	13	0
38	100 ³	54	66	99	0
39	99 ³	0	0	16	0
40	100 ³	54	100	16	0
41	100	0	23	41	0
42	—	0	23	0	0
43	100 ³	62	45	62	0
44	100 ³	62	0	0	0
45	100 ³	0	0	0	67
46	100 ³	0	0	17	0
47	50 ¹	0	0	0	0
48	92 ³	61	0	0	0
49	36	16	0	56	0
50	99 ³	0	0	56	0
51	100 ³	4	0	56	63
52	100 ³	57	0	10	36
53	100 ³	4	0	83	36
54	95	43	0	10	0
55	59 ³	81	0	74	0

Tabulka 13 - pokračování

Sloučenina číslo	Zk. A ¹	Zk. B	Zk. C	Zk. D	Zk. E
56	57 ³	92	0	17	0
57	91	12	23	99	37
58	98	—	—	—	—
59	100	56	0	8	0

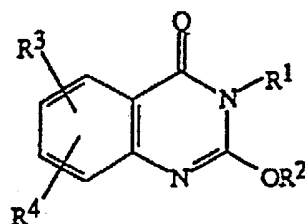
¹ Zkouška byla prováděna při 10 ppm, pokud není uvedeno jinak.

² Zkouška byla prováděna při 40 ppm.

³ Zkouška byla prováděna při 2 ppm.

PATENTOVÉ NÁROKY

1. Kondenzované bicycklické pyrimidinony obecného vzorce I



(I),

kde

Q představuje atom kyslíku;

R¹ představuje alkylskupinu se 3 až 10 atomy uhlíku, cykloalkylskupinu se 3 až 5 atomy uhlíku nebo cyklopropylmethylskupinu;

R² představuje alkylskupinu se 3 až 10 atomy uhlíku nebo cykloalkylskupinu se 6 až 7 atomy uhlíku;

R³ představuje atom halogenu; a

R⁴ představuje atom vodíku nebo atom halogenu;

přičemž když R¹ představuje cyklopropylmethylskupinu, potom R² znamená skupinu vzorce CH₂CH₂CH₃, R³ představuje 6-brom a R⁴ představuje atom vodíku.

2. Kondenzované bicycklické pyrimidinony podle nároku 1 obecného vzorce I, kde R¹ představuje alkylskupinu se 3 až 8 atomy uhlíku a R² představuje alkylskupinu se 3 až 8 atomy uhlíku.

3. Kondenzované bicycklické pyrimidinony podle nároku 2 zvolené ze souboru sestávajícího z 6-brom-3-propyl-2-propyloxy-4(3H)-chinazolinu a 6-jod-3-propyl-2-propyloxy-4(3H)-chinazolinonu.

4. Kondenzované bicyklické pyrimidinony podle nároku 1 zvolené ze souboru sestávajícího z 6-brom-3-(cyklopropylmethyl)-2-propyloxy-4(3H)-chinazolinu a 6,8-dijod-3-propyl-2-propyloxy-4(3H)-chinazolinonu.

5

5. Kondenzované bicyklické pyrimidinony podle nároku 1 zvolené ze souboru sestávajícího z (1) ze sloučenin kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje n-propylskupinu, n-decylskupinu, cyklopropylskupinu, n-butylskupinu, izopropylskupinu, cyklobutylskupinu, n-pentylskupinu, izobutylskupinu, cyklopentylskupinu, n-hexylskupinu nebo sek. butylskupinu, R^2 představuje n-propylskupinu, a buď R^4 představuje atom vodíku a R^3 představuje 6-brom nebo 6-jod, nebo R^4 představuje 8-jod a R^3 představuje 6-jod; (2) ze sloučenin kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje n-propylskupinu, R^2 představuje izobutylskupinu, n-decylskupinu, *terc*-butylskupinu, *sek*-butylskupinu, cyklohexylskupinu, izopropylskupinu, n-pentylskupinu, n-butylskupinu nebo n-hexylskupinu, a buď R^4 představuje atom vodíku a R^3 představuje 6-brom nebo 6-jod, nebo R^4 představuje 8-jod a R^3 představuje 6-jod; (3) ze sloučenin kde Q představuje atom kyslíku, R^1 a R^2 představuje vždy n-propylskupinu, a R^3 představuje 6-chlor a R^4 představuje 8-brom, R^3 představuje 6-brom a R^4 představuje 8-chlor nebo 7-brom, nebo R^3 představuje 8-brom a R^4 představuje atom vodíku; (4) ze sloučenin kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $CH_2CH_2CH_3$, R^2 představuje $CH_2CH_2CH_3$, R^4 představuje atom vodíku a R^3 představuje 6-brom, 7-chlor, 5-chlor, 7-fluor, 6-chlor nebo 6-jod; (5) ze sloučenin kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $CH_2CH_2CH_3$, R^3 představuje 6-brom, R^4 představuje atom vodíku a R^2 představuje $(CH_2)_3CH_3$, izopropylskupinu, $(CH_2)_4CH_3$, $(CH_2)_5CH_3$ nebo $CH_2CH_2C(CH_3)_3$; (6) ze sloučenin kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $CH_2CH_2CH_3$, R^2 představuje $CH_2CH_2CH_3$ a R^3 a R^4 představují 6-chlor a 8-chlor, 6-brom a 8-brom nebo 6-jod a 8-jod; (7) ze sloučenin kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $CH_2CH_2CH_3$, R^3 představuje 6-chlor, R^4 představuje atom vodíku a R^2 představuje izopropylskupinu nebo $(CH_2)_4CH_3$; (8) ze sloučenin kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $(CH_2)_3CH_3$, R^3 představuje 6-brom, R^4 představuje atom vodíku a R^2 představuje $CH_2CH_2CH_3$ nebo $(CH_2)_3CH_3$; (9) ze sloučenin kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $CH_2CH_2CH_3$, R^3 představuje 6-jod, R^4 představuje atom vodíku a R^2 představuje $(CH_2)_4CH_3$ nebo $CH_2CH_2CH_3$; (10) ze sloučenin kde Q představuje atom kyslíku, R^2 představuje $CH_2CH_2CH_3$, R^3 představuje 6-brom, R^4 představuje atom vodíku a R^1 představuje $CH_2CH(CH_3)_2$, (cyklopropyl) CH_2 nebo $CH(CH_3)ethyl$; (11) ze sloučenin, kde Q představuje atom kyslíku, R^1 a R^2 představuje vždy $(CH_2)_4CH_3$, R^3 představuje 6-brom a R^4 představuje atom vodíku; a (12) ze sloučenin kde Q představuje atom kyslíku, R^1 představuje $(CH_2)_3CH_3$, R^3 představuje 6-jod, R^4 představuje atom vodíku a R^2 představuje $(CH_2)_3CH_3$ nebo $CH_2CH_2CH_3$.

6. Kondenzovaný bicyklický pyrimidinon podle nároku 1, kterým je 6-jod-3-propyl-2-propyloxy-4(3H)-chinazolinon.

7. Fungicidní prostředek pro potlačování padlí travního na pšenici, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že obsahuje účinné množství kondenzovaného bicyklického pyrimidinonu podle nároku 6 a alespoň jednu složku zvolenou ze souboru sestávajícího z a) povrchově aktivní látky, b) organického rozpouštědla a c) alespoň jednoho pevného nebo kapalného ředidla.

8. Fungicidní prostředek pro potlačování padlí travního na pšenici, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že obsahuje účinné množství kombinace fungicidů zahrnující kondenzovaný bicyklický pyrimidinon podle nároku 6 a jinou sloučeninu potlačující padlí travní na pšenici, ale s odlišným způsobem působení.

9. Způsob potlačování padlí travního na pšenici, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že se účinné množství kondenzovaného bicyklického pyrimidinonu podle nároku 6 aplikuje na rostliny nebo na části rostlin, které mají být chráněny, nebo na média, v nichž chráněné rostliny rostou nebo na semena nebo na semenáčky chráněných rostlin.

10. Způsob potlačování padlí travního na pšenici, **vyznačující se tím**, že se účinné množství kombinace fungicidů zahrnující kondenzovaný bicyklický pyrimidinon podle nároku 6 a jinou sloučeninu potlačující padlí travní na pšenici, ale s odlišným způsobem působení, aplikuje na rostliny nebo na části rostlin, které mají být chráněny, nebo na média, v nichž chráněné rostliny rostou nebo na semena nebo na semenáčky chráněných rostlin.
11. Fungicidní prostředek pro potlačování padlí travního na pšenici, **vyznačující se tím**, že obsahuje účinné množství kondenzovaného bicyklického pyrimidinonu podle nároku 1 a alespoň jednu složku zvolenou ze souboru sestávajícího z a) povrchově aktivní látky, b) organického rozpouštědla a c) alespoň jednoho pevného nebo kapalného ředidla.
12. Fungicidní prostředek pro potlačování padlí travního na pšenici, **vyznačující se tím**, že obsahuje účinné množství kombinace fungicidů zahrnující kondenzovaný bicyklický pyrimidinon podle nároku 1 a jinou sloučeninu potlačující padlí travní na pšenici, ale s odlišným způsobem působení.
13. Způsob potlačování padlí travního na pšenici, **vyznačující se tím**, že se účinné množství kondenzovaného bicyklického pyrimidinonu podle nároku 1 aplikuje na rostliny nebo na části rostlin, které mají být chráněny, nebo na média, v nichž chráněné rostliny rostou nebo na semena nebo na semenáčky chráněných rostlin.
14. Způsob potlačování padlí travního na pšenici, **vyznačující se tím**, že se účinné množství kombinace fungicidů zahrnující kondenzovaný bicyklický pyrimidinon podle nároku 1 a jinou sloučeninu potlačující padlí travní na pšenici, ale s odlišným způsobem působení, aplikuje na rostliny nebo na části rostlin, které mají být chráněny, nebo na média, v nichž chráněné rostliny rostou nebo na semena nebo na semenáčky chráněných rostlin.

Konec dokumentu
