



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY  
A OBJEVY

# POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

203031

(11) (B2)

(51) Int. Cl.<sup>3</sup>  
A 01 N 37/22

(22) Přihlášeno 29 01 79  
(21) (PV 630-79)  
(32)(31)(33) Právo přednosti  
od 02 02 78 (19896 A/78) a  
od 04 07 78 (25295 A/78)  
Itálie

(40) Zveřejněno 30 04 80

(45) Vydáno 15 05 83

(72) Autor vynálezu

BOSONE ENRICO, MILÁN, CAMAGGI GIOVANNI, LODI (ITÁLIE), DE VRIES  
LAMBERTUS, HILVERSUM (NIZOZEMSKO), CARAVAGLIA CARLO, CUGGIONO,  
GARIASCHELLI LUIGI, PAVIA, GOZZO FRANCO, SAN DONATO MILANESE  
(ITÁLIE), OVEREEM JAN CORNELIUS, SCHERPENZEEL (NIZOZEMSKO)  
a LORUSSO SIMONE, SAN GIULIANO MILANESE (ITÁLIE)

(73) Majitel patentu

MONTEDISON S. p. A., MILÁN (ITÁLIE)

(54) Fungicidní prostředek a způsob výroby účinných látek

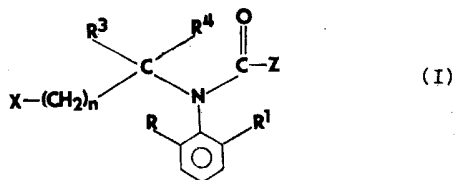
1

Vynález popisuje nové acylaniliny, zejména nové acylaniliny vykazující fungicidní účinky, způsob výroby těchto látek, prostředky obsahující zmíněné látky jako účinné složky a použití shora uvedených účinných látek a prostředků.

Baktericidní a fungicidní účinnost některých derivátů anilinu a glycinu, nesoucích na dusíkovém atomu různě substituovanou genylovou skupinu a acylové skupiny různého charakteru, byly již v poslední době popsány. Těmito acylovými skupinami mohou být zejména alfa- nebo beta-halogenalkancylové skupiny (viz DOS č. 2 513 789) nebo acetylové skupiny substituované v alfa-poloze atomem síry nebo kyslíkovou vazbou, čímž vznikají skupiny různého charakteru (viz francouzský patentový spis č. 7 510 722), nebo dále 2-furoylová skupina, 2-thienoylová skupina nebo pyridyl-2-karboxylová skupina (viz DOS č. 2 513 732 a 2 513 788).

Byla rovněž popsána mikrobicidní účinnost methylalaninátů nesoucích na dusíkovém atomu 2,6-dialkylfenylovou skupinu a některý ze zbytků vybraných ze skupiny zahrnující cyklopropencylový, akrolylový a krotonoylový zbytek (viz švýcarské přihlášky vynálezu č. 4998/74 a 2 906/75). Zájem věnovaný výzkumu nových acylanilinových derivátů vykazujících fungicidní účinnost vyplývá z nutnosti nalézt v této skupině sloučenin látky s vysokou fungicidní účinností v kombinaci s absencí fytoxicity. Některé již známé látky totiž, ačkoli vykazují vynikající fungicidní účinnost, jsou rovněž toxické pro rostliny, které mají před houbovými infekcemi chránit.

Nyní byly nalezeny nové fungicidně účinné acylaniliny odpovídající obecnému vzorci I



ve kterém

každý ze symbolů R a R<sup>1</sup>, které mohou být stejné nebo rozdílné, znamená atom vodíku, methylovou skupinu, ethylovou skupinu, skupinu -CH<sub>2</sub>-CH=CH<sub>2</sub> nebo -CH=CH-CH<sub>3</sub>,

každý se symbolů R<sup>3</sup> a R<sup>4</sup>, které mohou být stejné nebo rozdílné, znamená atom vodíku, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu, nebo R<sup>3</sup> a R<sup>4</sup> společně tvoří skupinu =CH<sub>2</sub>,

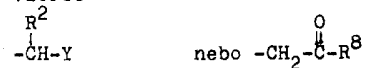
X představuje zbytek vzorce  $\text{-C-R}^9$

nebo  $\text{-C(=O)-O-R}^9$ , kde R<sup>9</sup> znamená alkylovou skupinu s 1 až 3 atomy

uhlíku, nebo představuje skupinu vzorce -CH(OCH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> nebo  $\text{-C(=O)-NHCH}_3$ ,

n má hodnotu 0 nebo 1

Z představuje fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou chlorem, methylovou skupinou nebo methoxyskupinou, dále představuje zbytek vzorce



kde

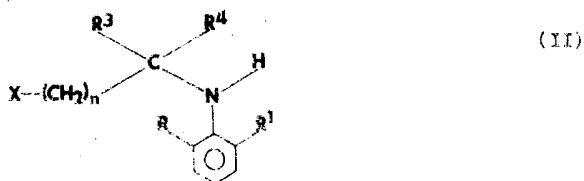
R<sup>2</sup> znamená atom vodíku nebo methylovou skupinu,

Y znamená fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou methoxyskupinu, cyklohexylovou skupinu, furylovou nebo thienylovou skupinu

R<sup>8</sup> znamená methylovou skupinu, chloromethylovou skupinu nebo methoxyskupinu.

Sloučeniny obecného vzorce I se vyznačují vysokou fungicidní účinností a nízkou fyto-toxicitou.

Acylaniliny shora uvedené obecného vzorce I se v souvislosti s vynálezem vyrábějí kondenzací anilinů obecného vzorce II



ve kterém

X, R, R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> mají shora uvedený význam.

se sloučeninou obecného vzorce III



ve kterém

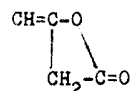
Z má shora uvedený význam,

v přítomnosti báze působící jako akceptor halogenovodíku nebo v přítomnosti dimethylformamidu.

Některé z anilinů obecného vzorce II jsou komerčně dostupné, jiné lze snadno získat známými reakcemi z 2,6-disubstituovaných anilinů.

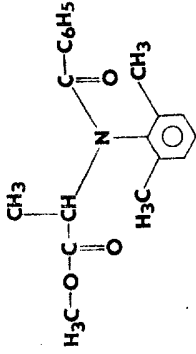
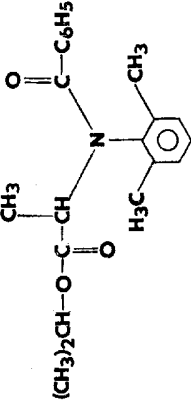
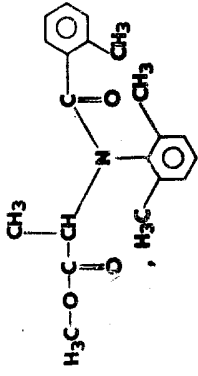
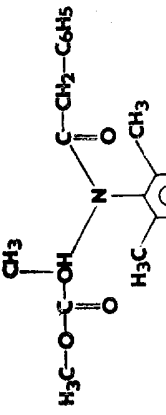
Jako příklady sloučenin obecného vzorce III je možno uvést benzoylchlorid, fenylacetylchlorid, monochlorid methylesteru malonové kyseliny ( $\text{Cl-CO-CH}_2\text{-COOCH}_3$ ), chlorid chloracet-  
octové kyseliny ( $\text{Cl-CO-CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{Cl}$ ) apod.

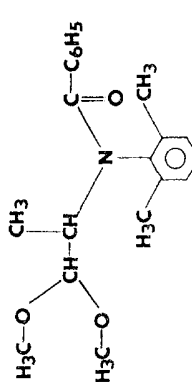
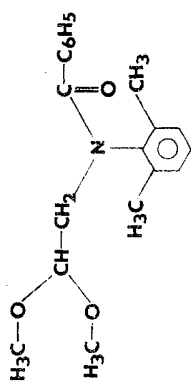
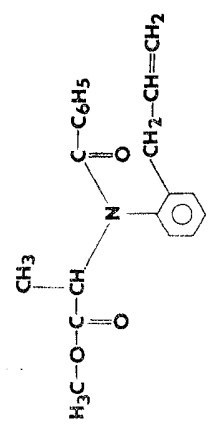
Sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém Z znamená zbytek  $-\text{CH}_2\text{-CO-R}^8$ , kde  $\text{R}^8$  představuje methylovou skupinu, lze alternativně získat reakcí anilinu shora uvedeného obecného vzorce I s diketenem vzorce

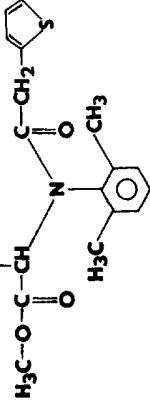
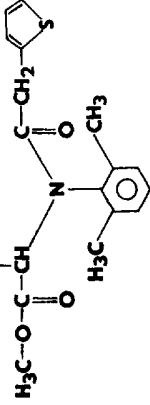
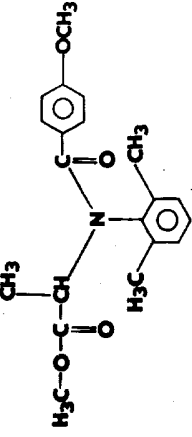
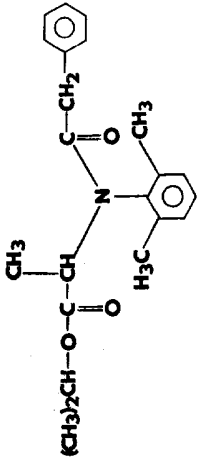
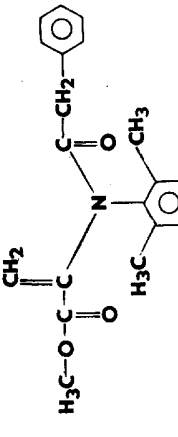


Způsobem podle vynálezu byly připraveny sloučeniny shrnuté do následující tabulky 1:

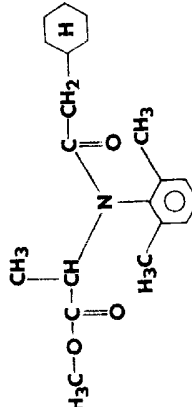
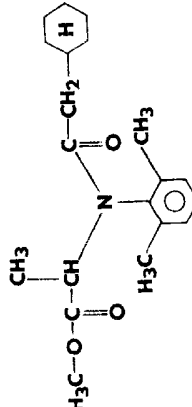
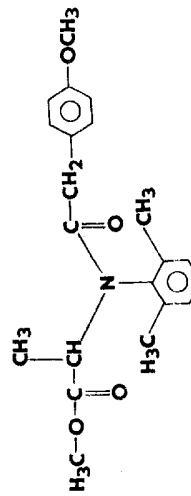
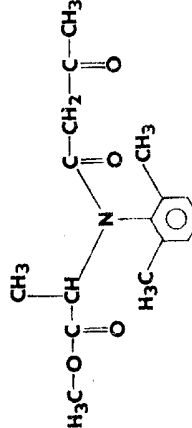
Tebalka 1

Slou- čenina číslo	Vzorec	Elementární analýza						(b)		(c)	
		Teplota tání (°C)		vypočteno		nalezeno		IČ <sub>max</sub> (cm <sup>-1</sup> )	NMR (δ, ppm)[TMS]		
1		3	4	5	6	7	8	9	10	11	1,04 (d, 3H, CH <sub>3</sub> -CH) 1,730 2,23 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -Ø) 1,745 2,29 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -Ø) 3,79 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -O) 4,30 (q, 1H, CH) 6,83-7,33 (m, 6H, aromatické protony)
2		97-100	74,31	7,42	4,13	74,45	7,77	4,25	1 630 1 715 1 720	1,2 (d, 3H, CH <sub>3</sub> -CH) 1,3 [d, 6H, (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH] 2,3 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -Ø) 2,32 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -Ø) 4,4 (q, 1H, CH <sub>3</sub> -CH) 5,2 [m, 1H, (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH] 6,8-7,5 (m, 8H, aromatické protony)	
3		114-115								1,20(d, 3H, CH <sub>3</sub> -CH) 2,27(s, 3H-CH <sub>3</sub> -Ø) 2,37(s, 3H, CH <sub>3</sub> -Ø) 2,47(s, 3H, CH <sub>3</sub> -Ø) 3,83(s, 3H, CH <sub>3</sub> -O) 4,30(q, 1H, CH <sub>3</sub> -CH) 6,63-7,20(m, 7H, aromatické protony)	
4		78-80	78,32	7,12	4,30	75,34	7,47	4,67	1 660 1 750	0,98 (d, 3H, CH <sub>3</sub> -CH) 1,85 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -Ø) 2,4 (s, 3H-CH <sub>3</sub> -Ø) 3,25 (s, 2H, CH <sub>2</sub> ) 3,8 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -O)	

Slou- ženina číslo	Vzorec	Teplota tání (a) (°C)	Elementární analýza (%)				IČ <sub>max</sub> (cm <sup>-1</sup> )	NMR (δ, ppm) [TMS]		
			C	H	N	nalezeno				
1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11
5		olej	73,37	7,70	4,18	75,4	8,4	4,3		4,45 (q, 1H, CH <sub>3</sub> -CH) 6,85-7,3 (m, 8H, aromatické protony)
6		58-59	72,81	7,40	4,47	73,14	7,66	4,69		2,2 (s, 6H, CH <sub>3</sub> -O) 3,3 (s, 6H, CH <sub>3</sub> -O) 3,9 (d, 2H, CH <sub>2</sub> -N) 4,95 (t, 1H, CH-O) 7-7,3 (m, 8H, aromatické protony)
7		olej	74,28	6,54	4,33	73,6	6,6	4,6		1,35; 1,65 (d, d, 3H, CH <sub>3</sub> -CH) 3,3 (m, 2H, CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub> ) 3,8 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -O) 4,8 (q, 1H, CH <sub>3</sub> -CH) 4,9; 5,15 (m, m, 2H -CH=CH <sub>2</sub> ) 5,6 (m, 1H, CH=CH <sub>2</sub> ) 7,1-7,35 (m, 9H, aromatické protony)

Sloučenina číslo	Vzorec	Teplota tání (°C)	Elementární analýza (%)				I <sub>C</sub> <sup>max</sup>	(c)		
			vypočteno		nalezeno				NMR	
		C	H	N	C	H	N	(cm <sup>-1</sup> ) (δ, ppm) [TMS]		
1		3	4	5	6	7	8	9	10 11	1,0 (d, 3H, CH <sub>3</sub> CH) 2,45 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -O) 2,45 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -O) 3,4 (s, 2H, CH <sub>2</sub> ) 3,8 (s, 3H, COOCH <sub>3</sub> ) 4,5 (q, 1H, CH <sub>3</sub> -CH) 6,5-7,3 (m, 6H)
8		63-64	65,23	6,39	4,23	66,53	6,74	4,54	1 655 1 745	
9		105-108	70,36	6,69	4,10	70,5	6,9	4,0	1 630 1 750	1,3 (d, 3H, CH <sub>3</sub> -CH) 2,3 (s, 6H, CH <sub>3</sub> -O) 3,7 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -O-θ) 3,85 (s, 3H, COOCH <sub>3</sub> ) 4,45 (q, 1H, CH <sub>3</sub> -CH) 6,75-7,6 (m, 7H, aromatické protony)
10		olej	74,76	7,70	3,96	73,84	7,91	3,99	1 650 1 730	1,2-1,45 (9H) 2,3 (s, 6H, CH <sub>3</sub> -O) 4,4 (q, 1H, N-CH) 5,2 (m, 1H, COOCH) 6,8-7,5 (m, 8H, aromatické protony)
11		56-57								2,05 (s, 6H, CH <sub>3</sub> -O) 3,4 (s, 2H, CH <sub>2</sub> -O) 3,85 (s, 3H, COOCH <sub>3</sub> ) 4,6-5,4 (d, d, 2H, CH <sub>2</sub> =C) 7,1-7,3 (m, 8H, aromatické protony)

Sloučenina číslo	Vzorec	Teplota tání (°C)	Elementární analýza (%)				I <sub>C</sub> <sup>max</sup> (cm <sup>-1</sup> )	NMR (δ, ppm) [TMS]		
			vypočteno	nalezeno	H	N				
1		3	C 4	H 5	N 6	C 7	H 8	N 9	10	11
12		51-52	C 74,31	H 7,42	N 4,13	C 74,03	H 7,52	N 4,07		
13		olej	C 74,31	H 7,42	N 4,13	C 72,96	H 7,16	N 4,34		
14		69-70	C 73,82	H 7,12	N 4,30	C 73,41	H 7,28	N 4,31		
15 (d)		97-100	C 65,99	H 5,83	N 4,05	C 67,0	H 5,9	N 3,7	1 630	1,27 (d, 3H, CH <sub>3</sub> -CH)
									1 730	2,3 (s, 6H, CH <sub>3</sub> -Ø)
									1 745	3,8 (s, 3H, COOHCH <sub>3</sub> )
										4,45 (q, 1H, CH <sub>3</sub> -CH)
										6,9-7,4 (m, 7H, aromatické protony)

Slou- ženina číslo	Vzorec	Teplota tání (a) (°C)	Elementární analýza (%)				I <sub>C</sub> <sup>max</sup> (cm <sup>-1</sup> )	(c)			
			vypočteno	nalezeno	H	N			MMR ( $\delta$ , ppm) [TMS]		
1		3	C 4	H 5	N 6	C 7	H 8	N 9	10	11	
16		60-64	72,47	8,82	4,22	71,75	9,12	3,81	1 650	1 750	
17		90-93	70,96	7,09	3,94	70,59	7,28	3,70	1 655	1 745	
18 (e)		olej									0,98 (d, 3H, CH <sub>3</sub> -CH) 2,12 2,15 (6H, CH <sub>3</sub> - $\theta$ ) 2,39 2,43 1,71 (3H, CH <sub>3</sub> -CO) 2,09 (CH <sub>2</sub> ) 2,92 (CH <sub>2</sub> ) 3,70 (s, 3H, CH <sub>3</sub> O) 4,33 (CH=C=OH) 4,40 (CH <sub>3</sub> -CH) 6,96-7,26 (3H aroma- tické protony 13,93 (s, OH)



Slov-  
čenina  
číslo

Vzorec

Teplota  
tání (a)  
(°C)

Elementární analýza (%)  
vypočteno

(c)

NMR

$\nu_{\text{max}}$   
( $\text{cm}^{-1}$ )

nalezeno

H N

H N

C

H N

H N

C

H N

H N

C

H N

H N

C

H N

H N

C

H N

H N

C

H N

H N

C

H N

H N

C

H N

H N

C

H N

H N

C

H N

H N

C

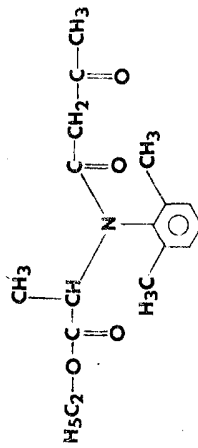
H N

H N

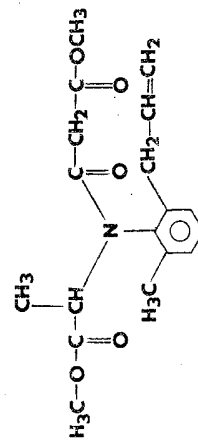
C

2

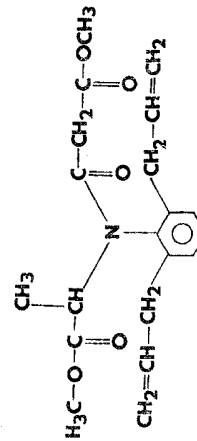
19(e)

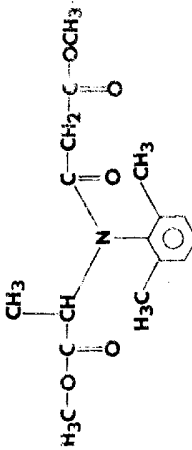
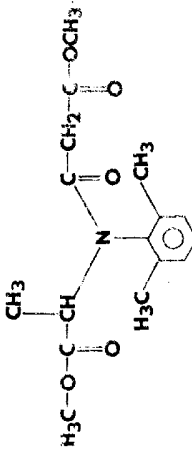
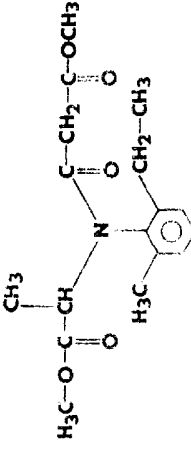
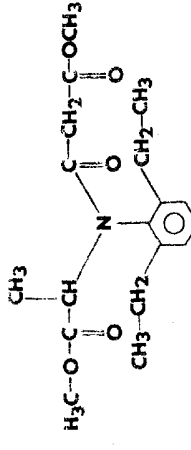


20



21



Slou- ženina číslo	Vzorec	Tepota tání (°C)	Elementární analýza (%)				(b)		(c)	
			vypočteno	nalezeno	IČ <sup>max</sup> (cm <sup>-1</sup> )	NMR (δ, ppm)[TMS]				
1		3	C 4	H 5	N 6	C 7	H 8	N 9	10	11
22		2	C 4	H 5	N 6	C 7	H 8	N 9	10	11
23		3	C 4	H 5	N 6	C 7	H 8	N 9	10	11
24		3	C 4	H 5	N 6	C 7	H 8	N 9	10	11

0,97 (3H,d,CH<sub>3</sub>-CH)  
 4,36 (1H,q,CH<sub>3</sub>-CH)  
 2,87 (2H,s,CH<sub>2</sub>)  
 3,60 (6H,s,s,OCH<sub>3</sub>)  
 3,73 (6H,s,s,OCH<sub>3</sub>)  
 2,20 (3H,s,CH<sub>3</sub>-Ø)  
 2,45 (3H,s,CH<sub>3</sub>-Ø)  
 7,0-7,2 (3H,m,aromatické protony)

0,97-0,99 (3H,d,d,CH<sub>3</sub>-CH)  
 1,27, (3H,t,CH<sub>3</sub>-CH<sub>2</sub>)  
 2,27-2,46 (3H,s,s,CH<sub>3</sub>-Ø)  
 2,85 (2H,s,CH<sub>2</sub>-CO)  
 2,27-3,17 (2H,m,CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>)  
 3,60-3,72 (6H,s,s,OCH<sub>3</sub>)  
 4,37 (1H,m,CH<sub>3</sub>-CH)  
 6,93-7,30 (3H,m,aromatické protony)

0,97 (3H,d,CH<sub>3</sub>-CH)  
 1,23 (6H,t,CH<sub>3</sub>-CH<sub>2</sub>)  
 2,83 (2H,s,CH<sub>2</sub>-CO)  
 2,13-3,17 (4H,m,CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>)  
 3,57-3,70 (6H,s,s,OCH<sub>3</sub>)  
 4,33 (1H,m,CH-CH<sub>3</sub>)  
 6,97-7,37 (3H,m,aromatické protony)

Slouč-  
 čina  
 Výsle  
 1

Vzorec

Teplota  
 tání (°C)

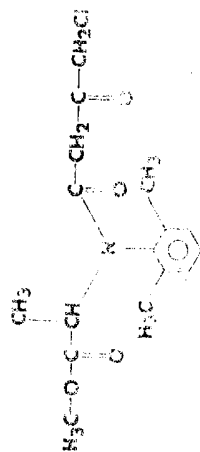
Elementární analýza (%)  
 vypočteno

(b)

nalezeno  
 H N C H N  
 5 6 7 8 9  
 IČ<sub>max</sub>  
 (cm<sup>-1</sup>) (δ, ppm) [TMS]

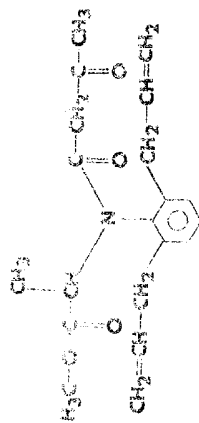
3  
 4  
 C  
 4

105-110



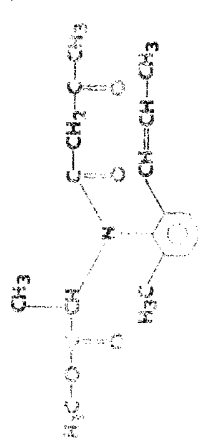
25

olej 69,95 7,34 4,08 68,60 7,30 4,32 1 630  
 1 650  
 1 720  
 1 745



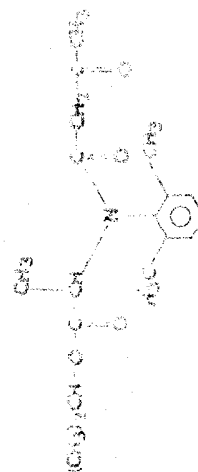
26

olej 68,12 7,30 4,41 65,85 7,49 4,35 1 630  
 1 650  
 1 715  
 1 745



27

olej 67,69 7,89 4,38 67,71 8,32 4,40 1 630  
 1 655  
 1 740

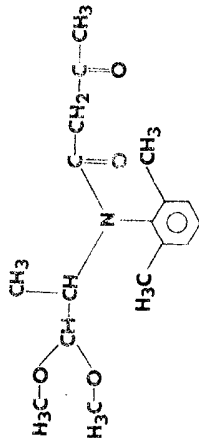


Slou- čenina číslo	Vzorec	Teplota tání (e) (°C)	Elementární analýza (%)					IC <sub>max</sub> (cm <sup>-1</sup> )	NMR (δ, ppm) [TMS]
			vypočteno	nalezeno	C	H	N		
1		3	C 4	H 5	N 6	C 7	H 8	N 9	10 11
29		olej	68,12	7,30	4,41	67,70	7,33	4,36	1 630 1 750
30		olej	67,31	6,98	4,62	66,2	6,90	4,90	1 630 1 650 1 720 1 740
31		84-87							
32		olej	52,12	7,49	4,53	61,06	7,84	4,47	1 660 1 745

Slou-  
ženina  
číslo  
1

Vzorec

2

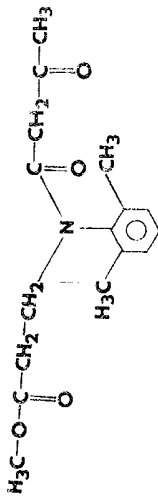


olej 66,43 8,20 4,56 65,76 8,43 4,89

Teplota tání (°C)	Elementární analýza (%)				IČ <sub>max</sub> (cm <sup>-1</sup> )	NMR (δ, ppm) [TMS]		
	vypočteno	nalezeno	H	N				
3	C 4	H 5	N 6	C 7	8	9	10	11

34(e)

65-68



2,19 (s, 3H, CH<sub>3</sub>-Ø)  
 2,22 (s, 3H, CH<sub>3</sub>-Ø)  
 2,62 (t, 2H, CH<sub>2</sub>)  
 3,78 (t, 2H, CH<sub>2</sub>)  
 3,55 (s, 3H, OCH<sub>3</sub>)  
 2,10 (s, CH<sub>3</sub>-CO)  
 1,73 (s, CH<sub>3</sub>-Q=)  
 OH

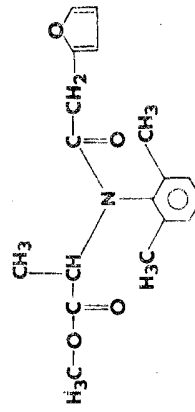
2,89 (s, CH<sub>2</sub>-CO)  
 4,27 (s, CH=C-)  
 OH

6,99-7,20 (m, 3H,  
 aromatické protony)

35

olej

68,55 5,71 4,44 67,61 6,70 4,57 1 655



1,0 (d, 3H, CH<sub>3</sub>-CH)  
 2,1 (s, 3H, CH<sub>3</sub>-Ø)  
 2,4 (s, 3H, CH<sub>3</sub>-Ø)  
 3,3 (s, 2H, CH<sub>2</sub>-CO)  
 3,8 (s, 3H, OCH<sub>3</sub>)  
 4,4 (q, 1H, CH<sub>3</sub>-CH)  
 5,9-7,5 (m, 6H, aro-  
 matické protony)

Slou-  
číslo  
číslo

Vzorec

Teplota  
tání (°C)

Elementární analýza (%)

(c)

NMR

IC<sub>max</sub>  
(cm<sup>-1</sup>) (δ, ppm) [TMS]

vypočteno  
C H N C H N

nalezeno  
H N

11

8 9

10

1 720 1,0 (3H,d,CH-CH<sub>3</sub>)

2,2-2,43 (6H, s,

CH<sub>3</sub>-Ø) 2,5 (3H, s,

COCH<sub>3</sub>) 4,5 (1H, q,

CH-CH<sub>3</sub>) 6,8-7,4

(8H, m, aromatické

protony)

1 710 0,8 (3H, d, CH-CH<sub>3</sub>)

1 635 1,9 (3H, s)

2,3 (3H, s) 2,4

(3H, s) 3,2 (2H, s,

COCH<sub>2</sub>) 4,6 (14, q,

CH-CH<sub>3</sub>) 6,6-7,3

(8H, m, aromatické

protony)

3 310 1,0 (3H, d, CH<sub>3</sub>-CH)

1 730 1,76-2,26 (3H, s,

1 670 CH<sub>3</sub>CO)

1 650 2,10-2,13 (6H, s, s,

CH<sub>3</sub>Ø) 2,8 (3H, d, NH-

-CH<sub>3</sub>) 3,06-4,33

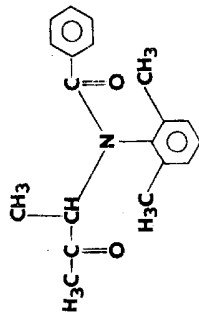
(2H, s, s, CH<sub>2</sub>CO) 4,7

(1H, m, CH-CH<sub>3</sub>)

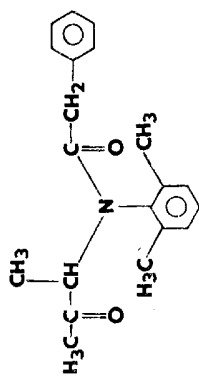
6,9-7,3 (3H, aroma-

tické protony)

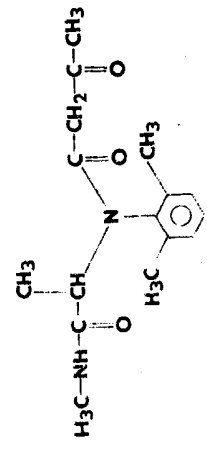
2

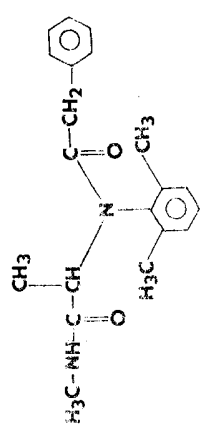
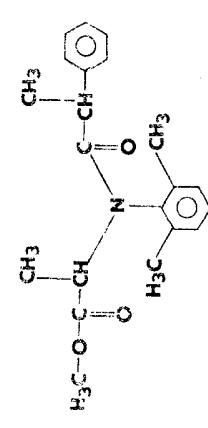
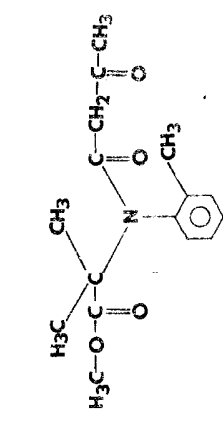
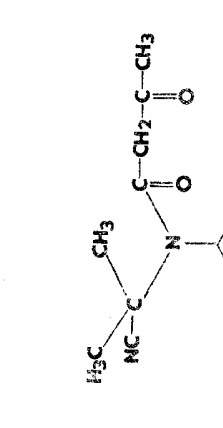


37



38



Sloučenina číslo	Vzorec	Teplota tání (°C)	Elementární analýza (%)				(b)		(c)		
			vypočteno	nalezeno	$I_{C_{max}}$ ( $cm^{-1}$ )	$I_{C_{max}}$ ( $cm^{-1}$ )	NMR ( $\delta$ , ppm) [TMS]	NMR ( $\delta$ , ppm) [TMS]			
39			C 73,52	H 7,14	N 9,04	C 73,53	H 7,17	N 9,27	3 380 1,0 (3H, s, CH-OH <sub>3</sub> ) 3 150 2-2,13 (6H, s, s, CH <sub>3</sub> ) 1 675 (2,8 (3H, d, NH-CH <sub>3</sub> )) 1 640 3,23 (2H, s, CH <sub>2</sub> CO) 4,76 (1H, q, CH <sub>3</sub> ) 6,9-7,4 (8H, m, aromatické protony)	10	11
40		104-106	C 74,31	H 7,42	N 4,13	C 74,18	H 7,56	N 3,94	1 755	1 645	
41									1,31, 1,46, 1,73, 2,04, 2,08, 2,38, 2,43 (12H, CH <sub>3</sub> ) 3,05 (s, CH <sub>2</sub> ) 4,30 (s, CH=) 2H 13,97 (s, OH) 3,79 (3H, s, OCH <sub>3</sub> ) 7,15-7,43 (4H, m, aromatické protony)		
42		94-95							1,63 (6H, s, CH <sub>3</sub> -C-OH <sub>3</sub> ) 1,77, 2,05 (3H, s, s, CH <sub>3</sub> -CO) 3,05 (s, CH <sub>2</sub> ) 4,35 (s, CH=) 2H 13,7 (s, OH) 6,99-7,67 (5H, m, aromatické protony)	203031	

olej

## Legenda:

- (a) teploty tání nejsou korigovány  
 (b) jsou uváděny pouze nejvýznamnější pásy  
 (c) NMR spektra sloučenin č. 1 a 3 byla měřena za použití tetrachlormethanu jako rozpouštědla, spektra ostatních sloučenin pak za použití deuterovaného chloroformu.  
 TMS = tetramethylsilan  
 Ø = fenyl  
 s = singlet  
 d = dublet  
 t = triplet  
 q = kvartet  
 m = multiplet  
 (d) elementární analýza:  
 vypočteno: 10,25 % Cl;  
 nalezeno: 9,68 % Cl.  
 (e) směs tautomerů

Sloučeniny obecného vzorce I vykazují vynikající fungicidní účinnost proti fytopathogenním houbám, a to jak účinnost preventivní (zabraňují vzniku choroby), tak kurativní (léčí chorobu již rozvinutou).

Zmíněné sloučeniny dále vykazují dobrou systemickou účinnost (tzn., že jsou přenášeny do různých částí rostliny), takže je lze aplikovat na list nebo do půdy.

Fungicidní účinnost některých sloučenin podle vynálezu proti *Plasmopara viticola* (B.et. C.) Berl et de Toni (peronospora révy vinné), *Peronospora tabacina* Adam (peronospora tabáková) a *Phytophthora infestans* (plíseň bramborová) je uvedena níže v tabulkách 2, 3, resp. 4.

Testy fungicidní účinnosti byly prováděny postupem popsaným níže v příkladech 14 až 22 a dosažené výsledky jsou v tabulkách 2, 3 a 4 udávány za pomoci stupnice 100 až 0, kde 100 znamená totální účinek (zdravé rostliny) a 0 představuje žádný účinek (silně zamořené rostliny).

Z údajů uvedených pro široce používaný komerční fungicid Zineb vyplývá, že sloučeniny podle vynálezu v porovnání s tímto standardním srovnávacím preparátem jsou ve stejných dávkách mnohem účinnější.

## T a b u l k a 2

Fungicidní účinnost proti *Plasmopara viticola* na vinné révě

Slouče- nina číslo	Dávka (%)	O š e t ř e n í							
		preventivní na list dny (a)		kurativní na list dny (a)		imunizační systemické na horní lis- ty dny (a)		systemické do půdy dny (a)	
		1	7	1	7	1	7	1	7
18(b)	1	100	100	100	100	100	100	100	100
	0,5	100	100	100	100	100	100	100	100
	0,1	100	100	100	100	100	100	100	100
19(c)	1	100	100			100			
	0,5	100							
	0,1	100							



Slouče- nina číslo	Dávka (%)	O š e t ř e n í							
		preventivní na list dny <sup>(a)</sup>		kurativní na list dny <sup>(a)</sup>		imunizační systemické na horní lis- ty dny <sup>(a)</sup>		systemické do půdy dny <sup>(a)</sup>	
		1	7	1	7	1	7	1	7
Zineb	1	90							
	0,5	70							
	0,1	30							

Legenda:

- (a) počet dnů mezi ošetřením a infekcí nebo naopak  
 (b) N-(2,6-dimethylfenyl)-N-acetacetyl-alfa-aminomethylpropionát  
 (c) N-(2,6-dimethylfenyl)-N-acetacetyl-alfa-aminoethylpropionát

T a b u l k a 3

Fungicidní účinnost proti *Peronospora tabacina*

Sloučenina číslo	Dávka (%)	O š e t ř e n í	
		preventivní na list dny <sup>(a)</sup> 2	kurativní na list dny <sup>(a)</sup> 2
18(b)	1	100	100
	0,5	100	100

Legenda: (a) počet dnů mezi ošetřením a infekcí nebo naopak  
 (b) N-(2,6-dimethylfenyl)-N-acetacetyl-alfa-aminomethylpropionát

T a b u l k a 4

Fungicidní účinnost proti *Phytophthora infestans* na rajčatech

Sloučenina číslo	Dávka (%)	O š e t ř e n í		
		preventivní na list dny <sup>(a)</sup> 1	kurativní na list dny <sup>(a)</sup> 1	systemické do půdy dny <sup>(a)</sup> 3
18(b)	1	100	100	100
	0,5	100	100	100
	0,1	-	-	100

Legenda: (a) počet dnů mezi ošetřením a infekcí nebo naopak  
 (b) N-(2,6-dimethylfenyl)-N-acetacetyl-alfa-aminomethylpropionát

V následující tabulce 5 jsou uvedeny hodnoty fungicidní účinnosti některých nových acylanilinů podle vynálezu a jejich fytotoxicita. Oba tyto údaje jsou porovnávány s obdobnými hodnotami zjištěnými pro preparáty "Furalaxyl" (známý produkt popsáný v DOS 2 513 788) a "Ridomil" (popsáný v DOS č. 2 515 091).

Uváděné hodnoty fungicidní účinnosti a fytotoxicity byly zjištěny postupem popsáným níže v příkladech 23 a 15. Ze srovnání uvedených hodnot vyplývá, že ve stejných aplikovaných dávkách vykazují sloučeniny podle vynálezu stejnou fungicidní účinnost jako preparáty "Furalaxyl" a "Ridomil", ale mnohem nižší fytotoxicitu.

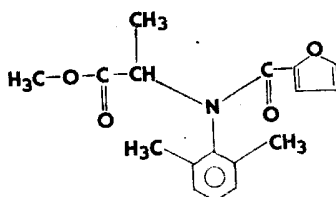
## T a b u l k a 5

Kurativní účinnost proti *Plasmopara viticola* na vinné révě

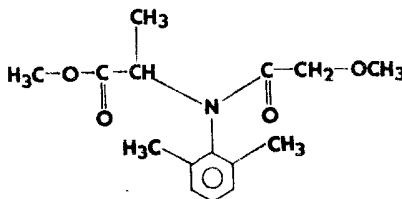
Účinná látka	Účinnost při aplikaci na list za 24 hodiny při infekci v dávce 0,1 %.	Index fytotoxicity při dávce 3 %.
1	100	25
2	100	0
3	100	5
4	100	10
Ridomil <sup>x)</sup>	100	100
"Furalaxyl" <sup>x)</sup>	100	100

Legenda:

x) "Furalaxyl" = N-(2,6-dimethylfenyl)-N-(1'-methoxykarbonylethyl)-2-furoylamid



"Ridomil" = N-(2,6-dimethylfenyl)-N-(1'-methoxykarbonylethyl)methoxyacetamid



Při použití fungicidů se nelze vyhnout určitým škodám způsobovaným fytotoxicitou těchto fungicidů. Mají se tedy aplikovat dávky představující nejlepší kompromis mezi fungicidní účinností dané látky a její fytotoxicitou.

Při praktických aplikacích v zemědělství závisí množství fungicidní látky zůstávající na rostlinách do značné míry na povětrnostních podmínkách (zejména na četnosti srážek), na správném ošetření a na četnosti ošetření prováděného zemědělcem. Je tedy proto nutné mít k dispozici fungicidní látky vykazující dobrou účinnost a současně vysokou bezpečnost při použití, takže ani vysoké dávky těchto látek nemohou rostliny poškodit.

V následující tabulce 6 je uvedeno srovnání fungicidní účinnosti některých sloučenin podle vynálezu v porovnání s účinností srovnávacích látek "Furalaxyl" a "Ridomil" při různých aplikovaných dávkách a fytotoxicita těchto sloučenin při stoupajících dávkách.

Ze srovnání uvedeného v tabulce 6 je zřejmé, že fungicidní účinnost srovnávacích látek, fytotoxicita látek podle vynálezu při stoupajících dávkách je však podstatně nižší.

T a b u l k a 6

Účinná látka	Kurativní účinnost proti Plasmopara viticola na vinné révě v dávkách (%)				Index.fytotoxicity v dávkách (%)			
	0,1	0,05	0,01	0,005	0,75	1,5	3	9
1	100	98	76	41			25	
2	100	80	70	60			0	0
4	100	100	100	100	0	0	10	37
8	100	100	100	100			30	
Furalaxyl	100	100	100	100	32	53	100	100
Ridomil	100	100	100	100	30	54	100	100

V následujících tabulkách 7 a 8 jsou uvedeny hodnoty kurativní činnosti dalších sloučenin podle vynálezu, jejichž čísla odpovídají číslům uvedeným v tabulce I, proti peronosporě révy vinné (*Plasmopara viticola*) a proti peronosporě tabákové (*peronospora tabacina*).

Testy se provádějí postupem popsaným níže v příkladech 15, resp. 19. Účinné látky se aplikují v dávce 0,1 % a výsledky se udávají za pomoci stupnice 100 až 0, kde 100 znamená totální účinek (zdravé rostliny) a 0 žádný účinek (zcela zamořené rostliny).

T a b u l k a 7

Kurativní účinnost proti *Plasmopara viticola*

Sloučenina číslo	Účinnost
5	100
6	82
9	44
10	100
11	74
12	82
13	95
14	29
16	58
17	69
20	100
21	100
22	100
23	89
25	69
26	94
27	100
28	80
29	100
31	44
32	68
34	100
35	100
36	43
37	57
38	25
39	27

## T a b u l k a 8

Kurativní účinnost proti *Peronospora tabacina*

Sloučenina číslo	Účinnost
7	72
15	64
24	64
30	53
33	93
40	84
41	70
42	25

Vynález ilustrují následující příklady provedení, jimiž se však rozsah vynálezu v žádném směru neomezuje.

## P ř í k l a d 1

Příprava N-(2,6-dimethylfenyl)-N-acetoacetyl-alfa-amino-methylpropionátu (sloučenina 18 z tabulky 1)

K 14,5 g methylesteru N-(2,6-dimethylfenyl)-2-aminopropionové kyseliny ve 25 ml toluenu se přidá 7,06 g čerstvě destilovaného diketenu a reakční směs se 24 hodiny zahřívá k varu pod zpětným chladičem. Po ochlazení se směs odpaří a zbytek se vyčistí chromatografií na silikagelu za použití chloroformu jako elučního činidla. Získá se 20 g žádaného produktu ve formě oleje. Výtěžek odpovídá 98 % teorie.

Struktura přisouzená tomuto produktu byla potvrzena NMR spektroskopií. Jak vyplývá ze signálů pro různé protony, uvedených v tabulce 1, rezultuje za použitých reakčních podmínek tato sloučenina ve formě směsi tautomerů.

## P ř í k l a d 2

Příprava N-(2,6-diallylphenyl)-N-acetoacetyl-alfa-amino-methylpropionátu (sloučenina 26 z tabulky 1)

0,02 mol methylesteru N-(2,6-diallylphenyl)-alfa-aminopropionové kyseliny se rozpustí v 10 ml toluenu, k roztoku se přidá 0,025 mol čerstvě destilovaného diketenu a reakční směs se 24 hodiny zahřívá k varu pod zpětným chladičem. Po ochlazení se směs odpaří a zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití směsi hexanu a ethylacetátu (4:1) jako elučního činidla.

Získá se žádaný produkt ve formě oleje, ve výtěžku 3 g.

## P ř í k l a d 3

Příprava N-(2-allylphenyl)-N-acetoacetyl-alfa-amino-methylpropionátu (sloučenina 30 z tabulky 1)

0,02 mol methylesteru N-(2-allylphenyl)-alfa-aminopropionové kyseliny se rozpustí ve 20 mililitrech benzenu, k roztoku se přidá 0,5 mol pyridinu a 0,25 mol čerstvě destilovaného diketenu. Reakční směs se 10 hodin zahřívá k varu pod zpětným chladičem, pak se ochladí, zředí se benzenem a promyje se 1% roztokem chlorovodíku a vodou. Organická fáze se oddělí, vysuší se síranem sodným a rozpouštědlo se odpaří. Zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití směsi hexanu a ethylacetátu (4:1) jako elučního činidla.

Získají se 3 g žádaného produktu ve formě oleje.

P ř í k l a d 4

Postupy popsány v příkladech 1, 2 a 3 se z odpovídajících výchozích látek připraví sloučeniny 19, 27, 28, 29, 31, 33 a 34 z tabulky 1.

P ř í k l a d 5

Příprava N-(2-methyl-6-allylphenyl)-N-(karboxymethylacetyl)-alfa-amino-methylpropionátu (sloučenina 20 z tabulky 1)

5 g (0,021 mol) methylesteru N-(2-methyl-6-allylphenyl)-alfa-aminopropionové kyseliny se rozpustí ve 120 ml toluenu a k roztoku se za míchání při teplotě místnosti během 15 minut přikape 3,5 g (0,027 mol) methylestermonochloridu kyseliny malonové ( $\text{ClCO-CH}_2\text{-COOCH}_3$ ). Reakční směs se 1 hodinu míchá při teplotě místnosti, načež se 5 hodin zahřívá k varu pod zpětným chladičem.

Po ochlazení se výsledný roztok zfiltruje a rozpouštědlo se odpaří. Olejovitý zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití směsi hexanu a ethylacetátu (3:1) jako elučního činidla. Získá se 4,6 g žádaného produktu ve formě červeného oleje.

P ř í k l a d 6

Příprava N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(2,2-dimethoxyethyl)methoxykarbonylacemidu (sloučenina 32 z tabulky 1)

K roztoku 4,45 g (0,02 mol) N-(2,2-dimethoxyethyl)-2,6-dimethylanilinu a 2,76 ml (0,02 mol) triethylaminu ve 25 ml ethyletheru se za míchání při teplotě 0 až 5 °C přikape 2,1 ml (0,02 mol) methylestermonochloridu kyseliny malonové.

Reakční směs se míchá nejprve 1 hodinu při teplotě 0 °C a pak 10 minut při teplotě místnosti, zfiltruje se a filtrát se promyje nejprve dvakrát vždy 10 ml 5% roztoku chlorovodíku a pak se promývá vodou až do neutrálního pH (3x10 ml).

Organická fáze se vysuší bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se odpaří. Žlutý olejovitý zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití směsi hexanu a ethylacetátu (7:3) jako elučního činidla. Získá se 2,1 g žádaného produktu ve formě oleje.

P ř í k l a d 7

Postupem podle příkladu 5 nebo 6 se z odpovídajících výchozích látek připraví sloučeniny 21, 22, 23, 24 a 25 z tabulky 1.

P ř í k l a d 8

Příprava N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(1-methoxykarbonylethyl)fenylacetemidu (sloučenina 4 z tabulky 1)

K roztoku 21,2 g N-(1-methoxykarbonylethyl)-2,6-dimethylanilinu (čistota 95 %, 0,1 mol) ve 150 ml toluenu a 1 ml dimethylformamidu se při teplotě místnosti během 30 minut přikape 17 g (0,11 mol) fenylacetylchloridu. Reakční směs se míchá nejprve 1 hodinu při teplotě místnosti a pak 3 hodiny za varu pod zpětným chladičem, znovu se ochladí na teplotu místnosti a promyje se nejprve 5% vodným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a pak vodou. Organická fáze se oddělí, vysuší se bezvodým síranem sodným, rozpouštědlo se odpaří a surový

produkt se překrystaluje z ligroinu (teplota varu 75 až 120 °C). Získá se 26 g žádaného produktu ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 78 až 80 °C.

## P ř í k l a d 9

Postupem popsaným v příkladu 8 se z odpovídajících výchozích látek připraví sloučeniny 1, 2, 3, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 17 a 34 z tabulky 1 s tím, že sloučeniny 10, 13 a 34, které jsou při teplotě místnosti olejovité, se namísto krystalizací čistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití směsi hexanu a ethylacetátu (3:1) jako elučního činidla.

## P ř í k l a d 10

Příprava N-(2',2'-dimethoxyethyl)-N-(2,6-dimethylfenyl)benzamid (sloučenina 6 z tabulky 1)

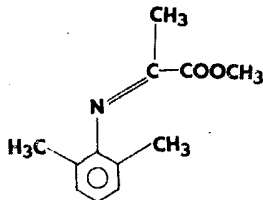
K roztoku 4,45 g /0,02 mol) N-(2',2'-dimethoxyethyl)-2,6-dimethylanilinu se 20 ml ethyletheru obsahujícího 2,76 ml (0,02 mol) triethylaminu se při teplotě 0 až 5 °C přikape během 20 minut 2,81 g (0,02 mol) benzoylchloridu. Reakční směs se 15 minut míchá při teplotě místnosti, pak se vzniklá sůl odfiltruje a filtrát se promyje nejprve 8 ml 5% vodného roztoku chlorovodíku a pak vodou do neutrálního pH. Organická fáze se vysuší bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se odpaří. Získá se 5,2 g bílé pevné látky, která po překrystalování z 25 ml petroletheru poskytne 4,5 g (65,5 %) bílého pevného produktu tajícího při 58 až 59 °C, čistotě 91 % (podle plynové chromatografie).

## P ř í k l a d 11

Postupem podle příkladu 10 se za použití N-(1'-methyl-2',2'-dimethoxyethyl)-2,6-dimethylanilinu a benzoylchloridu jako výchozích látek připraví N-(1'-methyl-2',2'-dimethoxyethyl)-N-(2,6-dimethylfenyl)benzamid (sloučenina 5 z tabulky 1) ve formě čirého oleje.

## P ř í k l a d 12

Příprava N-(methyl-methoxykarbonylmethylen)-2,6-dimethylanilinu



K roztoku 37,2 ml (0,3 mol) 2,6-dimethylanilinu ve 200 ml benzenu se přidá 0,5 g chloridu zinečnatého a pak se k němu přikape při teplotě místnosti 33,2 ml (0,33 mol) methylesteru kyseliny pyrohroznové. Reakční směs se 7 hodin zahřívá k varu pod zpětným chladičem, přičemž se z ní azeotropicky oddestilovává reakcí vznikající voda. Po odpaření rozpouštědla se získá 65 g olejovitého zbytku, který se podrobí destilaci, při níž se odebere frakce vroucí při 87 až 88 °C/9,3 Pa.

Tímto způsobem se získá 42,5 produktu o čistotě 92 % (podle plynové chromatografie). Výtěžek činí 63,5 %.

## P ř í k l a d 13

Příprava N-(2,6-dimethylfenyl)-N-(1'-methoxykarbonylvinylnyl)-fenylacetamidu (sloučenina 11 z tabulky 1)

K roztoku 6,7 g (0,03 mol) N-(methyl-methoxykarbonylmethylen)-2,6-dimethylanilinu (čistota 92 %, připraven postupem podle příkladu 12) ve 100 ml toluenu se při teplotě místnosti přikape 4,35 ml (0,033 mol) fenylacetylchloridu.

Reakční směs se zahřeje k varu pod zpětným chladičem a v proudu dusíku se 3 hodiny vaří, načež se rozpouštědlo odpaří. Získá se 10,8 g nažloutlého oleje, který po třítvaraci stvrdne.

Takto připravený surový produkt poskytně po krystalizaci z petroletheru 2 g (výtěžek 21 %)

žádaného bílého pevného produktu, který se podle chromatografie na tenké vrstvě čistý.

#### Příklad 14

Preventivní účinnost na peronosporu révy vinné [Plasmopara viticola (B. et C.) Berl et de Toni]

Listy vinné révy (kultivar Dolcetto), která se pěstuje v květináči v klimatizované komoře při teplotě 25 °C a 60% relativní vlhkosti, se po obou stranách ošetří postřikem testovanou látkou ve 20% vodném acetonovém roztoku (objemová %). V různých časových údobích od ošetření se pak spodní strany listů postřikají vodnou suspenzí konidií Plasmopara viticola (200 000 konidií/cm<sup>3</sup>), ponechají se 24 hodiny při teplotě 21 °C ve vlhké komoře (100% relativní vlhkost), načež se přenesou do klimatizované komory (21 °C, 70% relativní vlhkost), kde se 7 dnů inkubují. Po této době se vyhodnotí rozsah infekce za pomoci stupnice 100 (zdravé rostliny) až 0 (silně zamořené rostliny).

#### Příklad 15

Kurativní účinnost na peronosporu révy vinné [Plasmopara viticola (B. et C.) Berl et de Toni]

Listy vinné révy (kultivar Dolcetto), která se pěstuje v květináči v klimatizované komoře při teplotě 21 °C a 60% relativní vlhkosti, se na spodní straně postřikají vodnou suspenzí konidií Plasmopara viticola (200 000 konidií/cm<sup>3</sup>). Po 24 hodinách, kdy se rostliny uchovávají ve vlhké komoře (21 °C, 100% relativní vlhkost), se rostliny rozdělí do tří skupin. Rostliny z každé této skupiny se po 1, 2 resp. 3 dnech od infekce ošetří postřikem listů testovanými sloučeninami ve 20% (objem/objem) vodném acetonu.

Po sedmidenní inkubační době se vizuálně vyhodnotí rozsah infekce za použití stupnice 100 (zdravé rostliny) až 0 (úplně infikované rostliny).

#### Příklad 16

Imunizační účinnost na peronosporu révy vinné [Plasmopara viticola (B. et C.) Berl et de Toni]

Listy vinné révy (kultivar Dolcetto), která se pěstuje v květináči v klimatizované komoře, se na horní straně postřikají roztokem testované sloučeniny ve 20% vodném acetonu (objem/objem). Rostliny se 6 dnů udržejí v klimatizované komoře a sedmý den se pak jejich listy na spodní straně postřikají suspenzí konidií Plasmopara viticola (200 000 konidií/cm<sup>3</sup>). Infikované rostliny se 24 hodiny udržují ve vlhké komoře (100% relativní vlhkost), načež se znovu přenesou do klimatizované komory. Po sedmidenní inkubační době se vizuálně vyhodnotí rozsah infekce za použití stupnice 100 (zdravé rostliny) až 0 (úplně infikované rostliny).

## P ř í k l a d 17

Preventivní systemická účinnost na peronosporu révy vinné [Plasmopara viticola (B. et C.) Berl et de Toni]

Rostliny vinné révy (kultivar Dolcetto), pěstované v květináči v klimatizované komoře (25 °C, 60% relativní vlhkost) se ošetří tak, že do půdy v květináči zapraví 10% (objem/-objem) vodný acetonový roztok testované sloučeniny, v koncentraci 0,01 % (vztaženo na objem půdy).

Rostliny se dále udržují v klimatizované komoře a v různých časových intervalech od ošetření se jejich listy postřikají na spodní straně vodnou suspenzí konidií Plasmopara viticola (200 000 konidií/cm<sup>3</sup>). Pak se rostliny ponechají 24 hodiny ve vlhké komoře (21 °C, 100% relativní vlhkost), načež se na 7 dnů (inkubační perioda) znovu přenesou do klimatizované komory s teplotou 21 °C a 70% relativní vlhkostí. Rozsah infekce se vyhodnocuje za použití stupnice 100 (zdravé rostliny) až 0 (silně infikované rostliny).

## P ř í k l a d 18

Preventivní účinnost na peronosporu tabákovou (Peronospora tabacina Adam)

Listy rostlin tabáku (kultivar Burley), pěstované v květináči v klimatizované komoře, se po obou stranách ošetří postřikem testovanou sloučeninou ve 20% (objem/objem) vodném acetonu.

Za dva dny po tomto ošetření se listy na spodní straně postřikají vodnou suspenzí konidií Peronospora tabacina (200 000 konidií/cm<sup>3</sup>). Infikované rostliny se 6 hodin udržují ve vlhké komoře (100% relativní vlhkost), načež se k inkubaci houby přenesou do klimatizované komory s teplotou 20 °C a 70% relativní vlhkostí. Po šestidenní inkubační době se vizuálně vyhodnotí rozsah infekce za použití stupnice 100 (zdravé rostliny) až 0 (úplně infikované rostliny).

## P ř í k l a d 19

Kurativní účinnost na peronosporu tabákovou (Peronospora tabacina Adam)

Listy rostlin tabáku (kultivar Burley), pěstovaných v květináči v klimatizované komoře, se na spodní straně postřikají vodnou suspenzí konidií Peronospora tabacina (200 000 konidií/cm<sup>3</sup>). Infikované rostliny se ponechají 6 hodin ve vlhké komoře (100% relativní vlhkost), pak se rozdělí do dvou skupin a k inkubaci houby se přenesou do klimatizované komory, kde se udržuje teplota 20 °C a 70% relativní vlhkost. Za 24 a 48 hodin po infekci se první, resp. druhá skupina rostlin ošetří tak, že se listy rostlin z obou stran postřikají testovanou sloučeninou rozpuštěnou ve 20% (objem/objem) vodném acetonu.

Po šestidenní inkubaci se vizuálně vyhodnotí rozsah infekce za použití stupnice 100 (zdravé rostliny) až 0 (silně infikované rostliny).

## P ř í k l a d 20

Preventivní účinnost na plíseň bramborovou [Phytophthora infestans (Mont) de Bary]

Listy rostlin rajčete (kultivar Marmande), pěstovaných v květináči v klimatizované komoře při teplotě 26 °C a 60% relativní vlhkosti se postřikají roztokem testované sloučeniny ve 20% (objem/objem) vodném acetonu. Po 1 dnu se rostliny infikují tak, že se spodní strany jejich listů postřikají vodnou suspenzí konidií Phytophthora infestans (200 000 konidií/cm<sup>3</sup>). Infikované rostliny se ponechají 24 hodiny ve vlhké komoře při teplotě 21 °C



a 100% relativní vlhkosti, načež se k čtyřdenní inkubaci přenesou do jiné klimatizované komory, v níž se udržuje teplota 21 °C a 70% relativní vlhkost.

Po uplynutí této inkubační doby se vyhodnotí rozsah infekce za použití stupnice 100 (zdravé rostliny) až 0 (úplně infikované rostliny).

#### Příklad 21

Kurativní účinnost na plíseň bramborovou [*Phytophthora infestans* (Mont) de Bary]

Listy rostlin rajčete (kultivar Marmende), pěstovaných v klimatizované komoře při teplotě 26 °C a 60% relativní vlhkosti, se na spodní straně postříkají vodnou suspenzí konidií *Phytophthora infestans* (200 000 konidií/cm<sup>3</sup>).

Infikované rostliny se ponechají 24 hodiny ve vlhké komoře (100% relativní vlhkost), načež se jejich listy na obou stranách postříkají testovanou sloučeninou rozpuštěnou ve 20% (objem/objem) vodném acetonu. Po následující čtyřdenní inkubaci se vizuálně vyhodnotí rozsah infekce za použití stupnice 100 (zdravé rostliny) až 0 (úplně infikované rostliny).

#### Příklad 22

Preventivní systemická účinnost na plíseň bramborovou [*Phytophthora infestans* (Mont) de Bary]

Rostliny rajčete (kultivar Marmende), pěstované v květináči v klimatizované komoře při teplotě 26 °C a 60% relativní vlhkosti, se ošetří tak, že se do půdy v květináči zapraví 10% (objem/objem) roztok acetonu ve vodě, obsahující testovanou sloučeninu. Používá se koncentrace 0,01 % (vztaheno na objem půdy).

Rostliny se dále udržují v klimatizované komoře a po uplynutí 3 dnů od ošetření se jejich listy na spodní straně postříkají vodnou suspenzí konidií *Phytophthora infestans* (200 000 konidií/cm<sup>3</sup>). Infikované rostliny se 24 hodiny ponechají ve vlhké komoře (100% relativní vlhkost) při teplotě 21 °C, načež se přenesou do jiné klimatizované komory, v níž se udržuje 70% relativní vlhkost a teplota 21 °C. V této komoře se rostliny inkubují 4 dny.

Po uplynutí inkubační doby se vyhodnotí rozsah infekce za použití stupnice 100 (zdravé rostliny) až 0 (úplně infikované rostliny).

#### Příklad 23

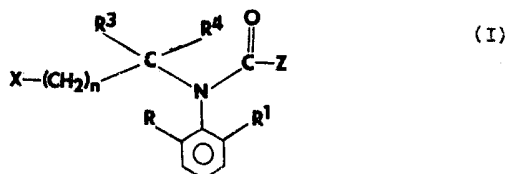
Stanovení fytotoxicity

Listy vinné révy (kultivar Dolcetto), pěstované v květináči v klimatizované komoře při teplotě 25 °C a 60% relativní vlhkosti, se ošetří tak, že se na obou stranách postříkají testovanou sloučeninou rozpuštěnou ve 20% (objem/objem) vodném acetonu.

Po 7 dnech se vizuálně vyhodnotí příznaky fytotoxicity, a to za použití stupnice 100 (úplně zničené rostliny) až 0 (zdravé rostliny).

## PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Fungicidní prostředek, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje alespoň jeden scylanilin obecného vzorce I



ve kterém

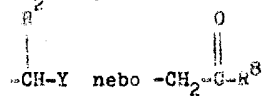
každý ze symbolů R a R<sup>1</sup>, které mohou být stejné nebo rozdílné, znamená atom vodíku, methylovou skupinu, ethylovou skupinu, skupinu -CH<sub>2</sub>-CH=CH<sub>2</sub> nebo -CH=CH-CH<sub>3</sub>,

každý ze symbolů R<sup>3</sup> a R<sup>4</sup>, které mohou být stejné nebo rozdílné, znamená atom vodíku, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu, nebo R<sup>3</sup> a R<sup>4</sup> společně tvoří skupinu =CH<sub>2</sub>,

X představuje zbytek vzorce  $\text{-}\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}\text{-R}^9$  nebo  $\text{-}\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}\text{-O-R}^9$ , kde R<sup>9</sup> znamená alkylovou skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, nebo představuje skupinu vzorce -CH(OCH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> nebo  $\text{-}\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}\text{-NHCH}_3$ .

n má hodnotu 0 nebo 1

Z představuje fenylevou skupinu, popřípadě substituovanou chlorem, methylovou skupinou nebo methoxyskupinou, dále představuje zbytek vzorce



kde

R<sup>2</sup> znamená atom vodíku nebo methylovou skupinu,

Y znamená fenylevou skupinu, popřípadě substituovanou methoxyskupinou, cyklohexylovou skupinu, furylovou nebo thianylovou skupinu a

R<sup>5</sup> znamená methylovou skupinu, chlormethylovou skupinu nebo methoxyskupinu.

2. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje sloučeninu shora uvedeného obecného vzorce I, ve kterém

R, R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, X a n mají význam jako v bodu 1 a

Z představuje zbytek vzorce  $\text{-}\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}\text{-R}^6$

kde

R<sup>6</sup> znamená methylovou skupinu, chlormethylovou skupinu nebo methoxyskupinu.

3. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje sloučeninu shora uvedeného vzorce I, ve kterém

R, R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, X a n mají význam jako v bodu 1 a

Z představuje fenylevou skupinu, popřípadě substituovanou chlorem, methylovou skupinou nebo methoxyskupinou, nebo představuje zbytek vzorce

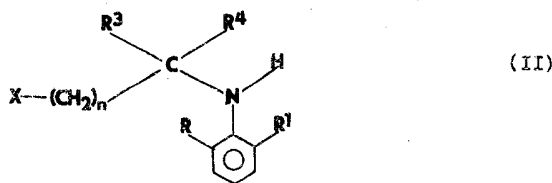


kde

$R^2$  znamená atom vodíku nebo methylovou skupinu a

Y znamená fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou methoxyskupinou, cyklohexylovou skupinu, furylovou skupinu nebo thienylovou skupinu.

4. Způsob výroby účinných látek podle bodu 1, vyznačující se tím, že se anilin obecného vzorce II



ve kterém

X, R,  $R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  a  $n$  mají shora uvedený význam,

nechá reagovat s chloridem karboxylové kyseliny obecného vzorce III



ve kterém

Z má shora uvedený význam,

v inertním rozpouštědle v přítomnosti dimethylformamidu nebo báze působící jako akceptor halogenovodíku.

5. Způsob podle bodu 4, k výrobě účinných látek podle bodu 2, vyznačující se tím, že se jako výchozí látky použijí sloučeniny shora uvedených obecných vzorců II a III, v nichž jednotlivé obecné symboly mají význam jako v bodu 2.

6. Způsob podle bodu 4, k výrobě účinných látek podle bodu 3, vyznačující se tím, že se jako výchozí látky použijí sloučeniny shora uvedených obecných vzorců II a III, v nichž jednotlivé obecné symboly mají význam jako v bodu 3.