ČESKOSLOVENSKÁ SOCIALISTICKÁ REPUBLIKA
(19)

ÚŘAD PRO VYNÁLEZY A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

225838

(11) (B2)

(51) Int. Cl.[3]
A 01 N 43/64
C 07 D 249/08

(22) Přihlášeno 18 05 81
(21) (PV 3671-81)

(32) (31)(33) Právo přednosti od 19 05 80
(P 30 19 049.9)
Německá spolková republika

(40) Zveřejněno 24 06 83

(45) Vydáno 15 01 86

(72) Autor vynálezu
SAUTER HUBERT dr., MANNHEIM, AMMERMANN EBERHARD dr., LUDWIGSHAFEN, RENTZEA COSTIN dr., HEIDELBERG, ZEEH BERND dr., LUDWIGSHAFEN, JUNG JOHANN dr., LIMBURGERHOF, POMMER ERNST-HEINRICH dr., LIMBURGERHOF (NSR)

(73) Majitel patentu
BASF AKTIENGESELLSCHAFT, LUDWIGSHAFEN (NSR)

(54) Fungicidní prostředek a prostředek k regulaci růstu rostlin

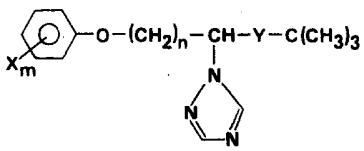
Vynález se týká nových cenných triazolylderivátů, způsobu jejich výroby, prostředků k ošetřování rostlin obsahujících tyto sloučeniny jako účinné látky a jejich použití.

Je již známo, že deriváty imidazolu, například 1-(2,4-dichlorfenyl-beta-allyléter)-imidazol (viz DOS č. 2 063 857) a triazolylderiváty, například 2,2-dimetyl-4-(1,2,4-triazol-1-yl)-5-fenylpentan-3-on (viz DOS č. 2 638 470) mají dobrou fungicidní účinnost. Účinek těchto látek však, při jejich aplikaci v nižších množstvích a koncentracích, není vždy uspokojivý. Naproti tomu je fungitoxický účinek často spojen s vysokou fytotoxicitou, takže v koncentracích potřebných k potírání hub při ochraně rostlin, například k potírání rzí, dochází rovněž k poškození kulturních rostlin. Z těchto důvodů nejsou shora zmíněné sloučeniny vždy vhodné (a ne u všech druhů rostlin) jako činidla k potírání hub při ochraně rostlin.

Dále je známo, že kvartérní amoniové sloučeniny, jako chlorcholinchlorid (CCC) /J. Biol. Chem. 235, 475 (1960)/, a určité triazolylderiváty, jako například 3-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-(4-chlorfenyl)-4,4-dimetylpentan-1-on (viz DOS č. 2 739 352), mají vliv na růst kulturních rostlin, a že je lze používat jako regulátory růst rostlin. Účinek těchto látek na regulování růstu rostlin není však vždy uspokojivý, a to zejména při jejich aplikaci v nižších množstvích.

Nyní byly nalezeny nové sloučeniny, které vykazují velmi vysokou fungitoxickou účinnost při vynikající snášitelnosti pro rostliny. Tyto nové sloučeniny mimoto i při aplikaci v nízkých množstvích vykazují silné účinky na regulaci růstu rostlin při velmi dobré snášitelnosti pro rostliny.

Vynález popisuje nové triazolylderiváty obecného vzorce I



(I)

ve kterém

X znamená atom vodíku, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, trifluormetylovou skupinu nebo fenylovou skupinu a m je celé číslo o hodnotě 1 až 2, přičemž v případě, že m má hodnotu 2, mohou být jednotlivé zbytky ve významu symbolu X stejné nebo rozdílné,

n je celé číslo o hodnotě 2 až 5 a

Y znamená skupinu CO nebo seskupení vzorce CR^1OR^2, kde R^1 představuje atom vodíku nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a R^2 představuje atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 3 až 4 atomy uhlíku nebo alkinylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku,

jakož i jejich adiční soli s kyselinami a komplexy se solemi kovů.

Ve sloučeninách obecného vzorce I podle vynálezu je uhlíkový atom substituovaný triazolylovým zbytkem chirální a účinné látky podle vynálezu tedy rezultují jako směsi enantiomerů, z nichž je možno oddělit individuální opticky aktivní sloučeniny. V případě alkoholů nebo éterů (Y = CR^1OR^2) se v důsledku přítomnosti dalšího centra chirality vyskytují směsi diastereomerů, které je možno obvyklým způsobem, například krystalizací nebo chromatografií, rozdělit na jednotlivé složky. Pro použití sloučenin podle vynálezu jako fungicidů nebo regulátorů růstu rostlin není však normálně potřebné dělení na individuální enantiomery nebo diastereomery.

Fenoxyskupina může být například substituována následujícími zbytky ve významu symbolu X_m:

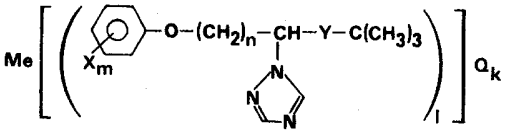
vodík,	2-chlor-4-fenyl,
2-fluor,	2-metyl-4-chlor,
4-fluor,	2-metyl,
2-chlor,	3-metyl,
3-chlor,	4-metyl,
4-chlor,	3-terc.butyl,
4-brom,	4-terc.butyl,
2,4-dichlor,	2-metoxy,
3,5-dichlor,	3-metoxy,
3,5-dimetoxy,	4-metoxy,
3-n-butoxy,	2-metoxy-4-metyl,
4-n-butoxy,	3-trifluormetyl,

R^1 znamená například atom vodíku, metylovou, etylovou, n-propylovou, isopropylovou nebo n-butylovou skupinu a

R^2 představuje například atom vodíku, metylovou, etylovou, n-propylovou, 2-propen-1-ylovou, 2-propin-1-ylovou, n-butylovou nebo 2-metyl-2-prop-1-enylovou skupinu.

Vhodnými adičními solemi s kyselinami jsou například bromidy, sulfáty, nitráty, fosfáty, oxaláty nebo dodecylbenzensulfonáty. Účinnost solí závisí na kationtu, takže volba aniontu je v podstatě libovolná.

Vhodnými komplexy s kovy jsou sloučeniny obecného vzorce VI

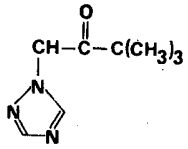


(VI)

ve kterém

X_m, n, Z a Y mají shora uvedený význam,
Me představuje kov, například měď, zinek, cín, mangan, železo, kobalt nebo nikl,
Q znamená aniont enorganické kyseliny, například kyseliny chlorovodíkové, kyseliny sírové, kyseliny fosforečné nebo kyseliny bromovodíkové a
l a k jsou čísla o hodnotě 1, 2, 3 nebo 4.

Vynález rovněž zahrnuje způsob výroby triazolylderivátů shora uvedeného obecného vzorce I, vyznačující se tím, že se ketony obecného vzorce II

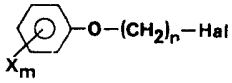


(II)

ve kterém

Z má shora uvedený význam,

nebo jejich alkalické enoláty, nechají reagovat s omega-aryloxyalkylhalogenidy obecného vzorce III



(III)

ve kterém

X, m a n mají shora uvedený význam a
Hal představuje chlor, brom nebo jod,

popřípadě v přítomnosti rozpouštědla nebo ředidla nebo/a enorganické či orgenické báze, při teplotě 0 až 100 °C, a takto získané sloučeniny obecného vzorce I, v němž Y představuje skupinu CO, se popřípadě působením komplexního hydridu nebo působením vodíku v přítomnosti hydrogenačního katalyzátoru, popřípadě v přítomnosti rozpouštědla nebo ředidla při teplotě 0 až 100 °C převedou na odpovídající sekundární alkoholy obecného vzorce I, v němž Y představuje skupinu CHOH, nebo se podrobí reakci s Grignardovým činidlem obecného vzorce IV

$$R^1\text{-MgHal} \qquad \text{(IV)}$$

ve kterém

R^1 znamená alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a
Hal představuje chlor, brom nebo jod,

popřípadě v přítomnosti rozpouštědla nebo ředidla a popřípadě v přítomnosti magnesium- nebo tetraalkylamoniumhalogenidu při teplotě 0 až 100 °C, a takto vzniklé alkoxidy se pak hydrolyzují na terciární alkoholy a takto získané sekundární nebo terciární alkoholy nebo jejich soli s alkalickými kovy či kvartérní amoniové soli se podrobí reakci s alkylačním činidlem obecného vzorce V

ve k

$$L\text{-}R^2 \qquad (V)$$

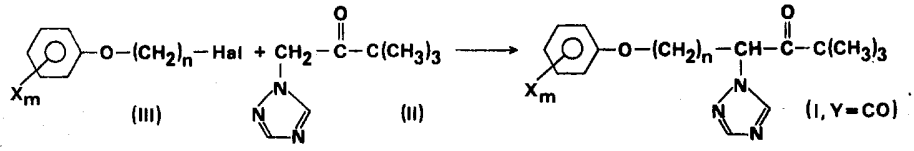
ve kterém

R^2 znamená alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 3 až 4 atomy uhlíku nebo alkinylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku a

L představuje nukleofilní odštěpující se skupinu,

popřípadě v přítomnosti rozpouštědla nebo ředidla nebo/a anorganické či organické báze nebo/a urychlovače reakce, při teplotě 0 až 100 °C, a takto získané sloučeniny obecného vzorce I se pak popřípadě převedou na své, pro rostliny snášitelné adiční soli s kyselinami nebo kovové komplexy.

Způsob výroby ketonů obecného vzorce I, ve kterém R znamená skupinu CO, spočívá v tom, že se známé ketony shora uvedeného obecného vzorce II (viz DOS č. 2 638 740), nebo jejich alkalické enoláty, nechají reagovat s omega-aryloxyalkylhalogenidy obecného vzorce III, popřípadě v přítomnosti báze nebo/a rozpouštědla či ředidla, za vzniku ketonů obecného vzorce Ia podle vynálezu. Shora uvedenou reakci je možno popsat následujícím reakčním schématem:



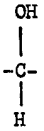
K výše uvedenému účelu se ketony obecného vzorce II nejprve metalují na alkalické enoláty, a to tak, že se s výhodou v přítomnosti polárního aprotického rozpouštědla, jako dimetylformamidu, acetonitrilu nebo tetrahydrofuranu, nechají reagovat s 0,8 až 1,2 ekvivalentu, výhodně s 1,0 ekvivalentu metalačního činidla, jako natriumhydridu, lithiumdiisopropylamidu nebo n-butyllithia, při teplotě 0 až 100 °C, s výhodou 10 až 50 °C. Po následujícím přidání 0,8 až 2,0, s výhodou 1,0 ekvivalentu příslušného omega-aryloxyalkylhalogenidu obecného vzorce III se při reakční teplotě 0 až 100 °C, s výhodou 5 až 30 °C, získají ketony obecného vzorce I.

Jedna z variant tohoto postupu spočívá v tom, že se ketony obecného vzorce II v přítomnosti 0,8 až 1,2, s výhodou 1,0 ekvivalentu báze, například terc.butoxidu draselného, metoxidu sodného nebo hydroxidu draselného, nechají reagovat s omega-aryloxyalkylhalogenidy obecného vzorce III, přičemž se účelně pracuje v přítomnosti rozpouštědla nebo ředidla, při teplotě 0 až 100 °C, s výhodou 5 až 50 °C.

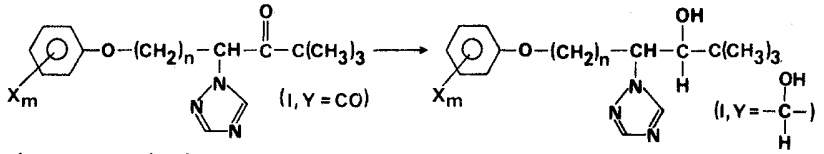
Jako rozpouštědla nebo ředidla přicházejí v tomto případě opět v úvahu dipolární aprotická rozpouštědla, ale i alkoholy, jako metanol nebo terc.butanol.

Omega-aryloxyalkylhalogenidy obecného vzorce III jsou známými sloučeninami nebo je lze snadno získat známým způsobem, například monoalkylací fenolů alifatickými dihalogenalkany, například 1,2-dibrometanem, 1,3-dichlorpropenem, 1,4-dibrombutanem nebo 1,5-dibrompentanem /viz Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, sv. 6/3, str. 54 až 59, Thieme Verlag, Stuttgart 1965, jakož i příklady 1b a 5/.

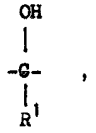
Způsob výroby sekundárních alkoholů obecného vzorce I, ve kterém Y představuje seskupení



spočívá v tom, že se ketony obecného vzorce I, ve kterém R znamená skupinu CO, podrobí redukci, například působením komplexních hydridů, s výhodou natriumborohydridu v přítomnosti polárního rozpouštědla, jako alkoholu, výhodně metanolu nebo etanolu, při teplotě 0 až 100 °C, a následující hydrolýze vodnými bázemi nebo kyselinami, nebo působení vodíku v přítomnosti hydrogenačního katalyzátoru, jako platiny nebo Raney-niklu, v přítomnosti polárního rozpouštědla, jako metanolu, etanolu či etylacetátu, při teplotě 20 až 100 °C a za tlaku 0,1 až 10 MPa. Shora uvedený postup je možno znázornit následujícím reakčním schématem:



Způsob výroby terciárních alkoholů obecného vzorce I, ve kterém Y představuje seskupení vzorce



v němž

R^1 představuje alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, ne však atom vodíku,

spočívá v tom, že se ketony obecného vzorce I (Y = CO) nechají reagovat s 0,8 až 1,2 ekvivalentu Grignardova činidla obecného vzorce IV

$$R^1\text{-MgHal} \qquad \text{(IV)}$$

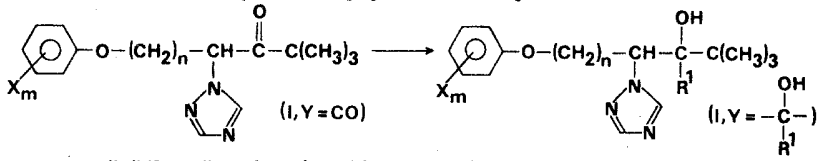
ve kterém

R^1 znamené alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a

Hal představuje chlor, brom nebo jod,

s výhodou v nepřítomnosti rozpouštědla a popřípadě v přítomnosti soli zvyšující výtěžek.

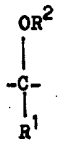
Shora uvedenou reakci je možno popsat následujícím reakčním schématem:



Jako rozpouštědla přicházejí s výhodou v úvahu étery, jako dietyléter, di-n-propyléter, tetrahydrofuran nebo anisol, déle terciární aminy, jako N,N-dietylanilin, jakož i tris(dimetylamid) kyseliny fosforečné. Reakci je možno popřípadě provádět i ve směsi těchto rozpouštědel s alifatickými či aromatickými uhlovodíky, jako s n-hexanem či toluenem. Jako soli zvyšující výtěžek, které potlačují obvyklé vedlejší reakce, přicházejí v úvahu zejména bezvodé halogenidy hořečnaté, jako bezvodý bromid hořečnatý, nebo bezvodé tetraalkylamoniumhalogenidy, jako například tetra-n-butylamoniumchlorid.

Reakční teploty se mohou, v závislosti na použitém rozpouštědle, pohybovat mezi 0 a 100 °C, přičemž výhodně se pracuje při teplotě 0 až 60 °C. Alkoxidy hořečnaté, primárně vznikající při této reakci, se pak hydrolýzou zředěnými vodnými kyselinami, jako kyselinou chlorovodíkovou, kyselinou sírovou nebo s výhodou kyselinou octovou nebo zvlášť výhodně vodným roztokem chloridu amonného, převedou na alkoholy, které se pak po odstranění vodné fáze popřípadě čistí obvyklým způsobem extrakcí, překrystalováním nebo chromatografií.

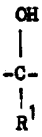
Způsob výroby éterů obecného vzorce I, v němž Y představuje seskupení vzorce



v němž

R^2 znamená alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 3 až 4 atomy uhlíku nebo alkinylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku,

spočívá v tom, že se sekundární nebo terciární alkoholy obecného vzorce I, ve kterém Y znamená seskupení



nebo jejich soli s alkalickými kovy či kvartérní amoniové soli, nechají reagovat s alkylačními činidly obecného vzorce V

$$L-R^2 \qquad (V)$$

popřípadě v přítomnosti rozpouštědla nebo ředidla a popřípadě v přítomnosti anorganické či organické báze nebo/a urychlovače reakce, při teplotě 0 až 100 °C.

Jako shora zmíněné nukleofilní odštěpující se skupiny ve významu symbolu L je možno uvést například atomy halogenů, výhodně chloru, bromu nebo jodu, alkylsulfátové zbytky, výhodně zbytek metylsulfátový, popřípadě substituované alkylsulfonyloxyskupiny, výhodně metansulfonyloxyskupinu nebo trifluormetansulfonyloxyskupinu, nebo arylsulfonyloxyskupiny, výhodně tosylátový zbytek.

Vhodnými anorganickými nebo organickými bázemi, které je popřípadě možno používat i jako činidla vázající kyselinu, jsou například hydroxidy alkalických kovů a kovů alkalických zemin, jako hydroxid sodný, hydroxid draselný a hydroxid vápenatý, uhličitany alkalických kovů, jako uhličitan draselný nebo uhličitan sodný, hydridy alkalických kovů, jako natriumhydrid, alkoxidy alkalických kovů nebo kovů alkalických zemin, jako metoxid sodný, metoxid hořečnatý nebo isopropoxid sodný, nebo terciární aminy, jako trimetylamin, trietylamin, N,N-dimetylanilin, N,N-dimetylcyklohexylamin, N-metylpiperidin nebo pyridin. Je však možno používat i jiné obvyklé báze.

Pomocí vhodných bází, například hydridu alkalického kovu, jako natriumhydridu, nebo alkyllithné sloučeniny, jako butyllithia, nebo alkoxidů alkalických kovů nebo kovů alkalických zemin, jako metoxidu sodného, je možno alkoholy obecného vzorce II rovněž převést nejprve na odpovídající alkoxidy a teprve ty pak nasazovat k reakci.

K výhodným rozpouštědlům, popřípadě ředidlům, náležejí halogenované uhlovodíky, jako například metylenchlorid, chloroform, 1,2-dichloretan nebo chlorbenzen, alifatické nebo aromatické uhlovodíky, jako cyklohexan, petroléter, benzen, toluen nebo xyleny, estery, jako etylacetát, amidy, jako dimetylformamid, nitrily, jako acetonitril, sulfoxidy, jako dimetylsulfoxid, ketony, jako aceton nebo metyletylketon, étery, jako dietyléter, tetrahydrofuran či dioxan, nebo odpovídající směsi těchto rozpouštědel.

Jako urychlovače reakce přicházejí v úvahu s výhodou halogenidy kovů, jako jodid draselný, crown-étery, kvartérní amoniové sloučeniny, jako tetrabutylamoniumjodid, nebo kyseliny, nebo kombinace těchto urychlovačů reakce.

Reakce podle vynálezu se obecně provádějí při teplotě mezi 0 a 100 °C, po dobu od 1 do 60 hodin, bez tlaku nebo za tlaku, kontinuálně nebo diskontinuálně.

Izolace sloučenin podle vynálezu se provádí obvyklými metodami. Obecně nepotřebují výsledné produkty žádné další čištění, lze je však nicméně dále čistit známými metodami, jako překrystalováním, extrakcí, destilací nebo chromatografií.

Je-li to žádoucí, lze sloučeniny obecného vzorce I podle vynálezu rovněž převádět na soli s anorganickými nebo organickými kyselinami, jako jsou například soli s kyselinou chlorovodíkovou, kyselinou bromovodíkovou, kyselinou dusičnou, kyselinou šťavelovou, kyselinou octovou, kyselinou sírovou, kyselinou fosforečnou nebo kyselinou dodecylbenzensulfonovou. Účinnost soli zakládá kationt, takže volba aniontu je v podstatě libovolná.

Dále je možno sloučeniny obecného vzorce I o sobě známými metodami převádět na kovové komplexy. Tuto konverzi je možno uskutečnit reakcí shora zmíněných sloučenin s vhodnými solemi kovů, jako například s chloridem měďnatým, chloridem zinečnatým, chloridem železitým, dusičnanem měďnatým, chloridem manganatým nebo bromidem nikelnatým.

Přípravu sloučenin obecného vzorce I podle vynálezu ilustrují následující příklady provedení, jimiž se však rozsah vynálezu v žádném směru neomezuje.

P ř í k l a d 1

a) Příprava intermediárního 1-brom-4-fenoxybutanu

Směs 329 g fenolu, 484 g suchého uhličitanu draselného, 756 g 1,4-dibrombutanu a 1 000 ml cyklopentanonu se za míchání 24 hodiny zahřívá k varu pod zpětným chladičem. Po odfiltrování pevného podílu se filtrát odpaří ve vakuu, olejovitý zbytek se vyjme 1 500 ml dichlormetanu a roztok se desetkrát extrahuje vždy 200 ml 15% vodného roztoku hydroxidu sodného. Organická fáze se ještě dvakrát extrahuje vždy 300 ml vody, pak se vysuší síranem hořečnatým, zfiltruje se a odpaří se ve vakuu. Ze zbytku se destilací při 92 až 98 °C/40 Pa získá 395 g bezbarvého 1-brom-3-fenoxybutanu, který v předloze ztuhne. Produkt taje při 36 až 36 °C.

b) Příprava výsledného 2,2-dimetyl-4-(1,2,4-triazol-1-yl)-8-fenoxyoktan-3-onu

K suspenzi 2,3 g natriumhydridu ve 20 ml dimetylformamidu se v atmosféře suchého dusíku za míchání přikape roztok 14,3 g 2,2-dimetyl-4-(1,2,4-triazol-1-yl)butan-3-onu (viz DOS č. 2 638 470) ve 20 ml dimetylformamidu. Během přidávání se teplota směsi udržuje mezi 20 a 30 °C. Reakční směs se míchá 20 hodin při teplotě místnosti, načež se k ní za míchání a chlazení ledem při teplotě 5 až 10 °C přikape roztok 19,5 g 1-brom-4-fenoxybutanu ve 20 ml dimetylformamidu. Po skončeném přidávání se výsledná směs ještě 10 hodin míchá při teplotě 5 až 10 °C, pak se k ní přidá 200 ml vody a směs se extrahuje dvakrát vždy 100 ml dichlormetanu. Ze spojených organických fází se po vytřepání vodou, vysušení síranem hořečnatým a odpaření rozpouštědla ve vakuu získá olej, který po trituraci s 20 ml diisopropyléteru poskytne 17 g bezbarvých krystalů o teplotě tání 59 až 62 °C.

P ř í k l a d 2

2,2-dimetyl-4-(1,2,4-triazol-1-yl)-8-fenoxyoktan-3-ol

K roztoku 600 g 2,2-dimetyl-4-(1,2,4-triazol-1-yl)-8-fenoxyoktan-3-onu v 1 000 ml metanolu se za varu pod zpětným chladičem a za míchání po částech přidá 72 g pevného natriumborohydridu. Po odeznění exotermní reakce se reakční směs odpaří ve vakuu k suchu, zbytek se rozmíchá s 500 ml vody a extrahuje se třikrát vždy 300 ml dichlormetanu. Spojené organické fáze se vysuší síranem hořečnatým, zfiltrují se a filtrát se odpaří ve vakuu. Ze zbyt-

ku se po promíchání s 200 ml diisopropyléteru izoluje 360 g bezbarvého krystalického produktu o teplotě tání 79 až 81 °C.

Příklad 3

2,2-dimetyl-3-metoxy-4-(1,2,4-triazol-1-yl)-8-fenoxyoktan

K suspenzi 1,6 g natriumhydridu v 50 ml dimetylformamidu se přikape roztok 15,4 g 2,2-dimetyl-4-(1,2,4-triazol-1-yl)-8-fenoxyoktan-3-olu v 50 ml dimetylformamidu a směs se ještě 2 hodiny míchá za varu pod zpětným chladičem. Po ochlazení na teplotu místnosti se přidá 3,7 ml metyljodidu, směs se 5 hodin míchá za varu pod zpětným chladičem, načež se k ní přidá 200 ml vody. Reakční směs se extrahuje třikrát vždy 100 ml dietyléteru, spojené extrakty se třikrát promyjí vždy 50 ml vody, vysuší se síranem hořečnatým a odpaří se ve vakuu. Zbytek je tvořen 2,2 g nažloutlého pryskyřičného produktu.

IČ (film): 2930, 2862, 1588, 1576, 1486, 1460, 1264, 1233, 1126, 1080, 1005, 745, 682 a 670 cm^{-1}.

Příklad 4

2,2-dimetyl-4-(1,2,4-triazol-1-yl)-6-fenoxyhexan-3-on

Analogickým postupem jako v příkladu 1b se nechají reagovat 2,6 g natriumhydridu, 16,7 g 2,2-dimetyl-4-(1,2,4-triazol-1-yl)-butan-3-onu a 20,1 g 1-brom-2-fenoxyetanu. Získá se 11,4 g žádaného produktu o teplotě tání 37 až 40 °C.

Příklad 5

2,2,3-trimetyl-4-(1,2,4-triazol-1-yl)-6-fenoxyhexan-3-ol

K roztoku 5,4 g metylmagnesiumbromidu ve 28 ml tetrahydrofuranu se přikape roztok 6,0 g 2,2-dimetyl-4-(1,2,4-triazol-1-yl)-6-fenoxyhexan-3-onu v 50 ml tetrahydrofuranu a směs se po odeznění mírně exotermní reakce nechá ještě 24 hodiny reagovat při teplotě místnosti. Reakční směs se vylije do 1 000 ml 10% vodného roztoku chloridu amonného a extrahuje se dvakrát vždy 200 ml dichlormetanu. Po promytí organické fáze a vysušení síranem hořečnatým se dichlormetan odpaří ve vakuu. Ze zbytku se po přidání 10 ml diisopropyléteru izoluje 1,5 g bílých krystalů tajících při teplotě 118 až 120 °C.

Další příklady sloučenin obecného vzorce I podle vynálezu jsou shrnuty do následující tabulky 1:

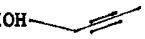
Tabulka 1

Příklad číslo	X_m	n	Y	Teplota tání (°C)
6	H	2	CHOH	84 až 88
7	H	2	$C(n\text{-}C_3H_7)OH$	
8	4-Cl	2	CO	62 až 66
9	4-Cl	2	CHOH	96 až 100
10	$2,4\text{-}Cl_2$	2	CO	56 až 58
11	$2,4\text{-}Cl_2$	2	CHOH	101 až 105
12	H	3	CO	55 až 58

pokračování tabulky 1

Příklad číslo	X_m	n	Y	Teplota tání (°C)
13	H	3	CHOH	79 až 82
14	4-Cl	3	CO	59 až 60
15	4-Cl	3	CHOH	121 až 126
16	4-Cl	4	CO	37 až 38
17	4-Cl	4	CHOH	76 až 78
18	3-CF_3	2	CO	36 až 37
19	3-CF_3	2	CHOH	89 až 92
20	2-Cl, 4-fenyl	2	CO	109 až 113
21	2-Cl, 4-fenyl	2	CHOH	105 až 107
22	3-CH_3	2	CO	46 až 48
23	3-CH_3	2	CHOH	104 až 107
24	H	3	$C(CH_3)OH$	162 až 163
25	2-F	2	CO	pryskyřice
26	2-F	2	CHOH	83 až 87
27	4-F	2	CO	pryskyřice
28	4-F	2	CHOH	77 až 82
29	3-Cl	2	CO	56 až 60
30	3-Cl	2	CHOH	85 až 88
31	3-Cl	3	CO	pryskyřice
32	3-Cl	3	CHOH	74
33	2,4-Cl_2	3	CO	57
34	2,4-Cl_2	3	CHOH	82 až 84
35	2,4-Cl_2	4	CO	76 až 77
36	2,4-Cl_2	4	CHOH	91 až 93
37	3,5-Cl_2	2	CO	108 až 113
38	3,5-Cl_2	2	CHOH	80 až 84
39	3-CH_3	3	CO	pryskyřice
40	3-CH_3	3	CHOH	62
41	3-CF_3	3	CO	pryskyřice
42	3-CF_3	3	CHOH	65 až 69
43	2-OCH_3	2	CO	pryskyřice
44	2-OCH_3	2	CHOH	pryskyřice
45	3-OCH_3	2	CO	90 až 92
46	3-OCH_3	2	CHOH	101 až 104
47	4-OCH_3	2	CO	69 až 72
48	4-OCH_3	2	CHOH	92 až 94
49	4-OCH_3	3	CO	84 až 85
50	4-OCH_3	3	CHOH	104 až 108
51	3,5-$(OCH_3)_2$	2	CO	91 až 95

pokračování tabulky 1

Příklad číslo	X_m	n	Y	Teplota tání (°C)
52	$3,5\text{-}(OCH_3)_2$	2	CHOH	104 až 105
53	H	4	$C(n\text{-}C_3H_7)OH$	
54	H	5	CO	61 až 63
55	H	5	CHOH	88 až 91
56	$3\text{-}OCH_3$	3	CO	pryskyřice
57	$3\text{-}OCH_3$	3	CHOH	69 až 72
58	H	4	CHO-	pryskyřice
59	H	4	CHOH- 	
60	H	4	$C(n\text{-}C_4H_9)OH$	
61	H	4	$C(CH_3)OH$	114 až 117
62	H	5	$CHOCH_3$	pryskyřice
63	H	5	CHO-	pryskyřice
64	$2\text{-}OCH_3$	3	CO	
65	$2\text{-}OCH_3$	3	CHOH	53 až 54
66	2-F	3	CO	
67	2-F	3	CHOH	76 až 77
68	3-F	2	CO	55 až 56
69	3-F	2	CHOH	
70	3-F	3	CO	49 až 50
71	3-F	3	CHOH	89 až 90
72	4-F	3	CO	
73	4-F	3	CHOH	110 až 112
74	4-F	4	CHOH	86 až 88
75	4-F	4	$C(CH_3)OH$	117 až 119
76	4-Cl	4	$C(CH_3)OH$	118 až 120
77	3-Cl	4	$C(CH_3)OH$	90
78	$3\text{-}CF_3$	4	$C(CH_3)OH$	80
79	$4\text{-}CH_3$	2	CHOH	103
80	$2,4\text{-}(CH_3)_2$	2	CHOH	118

Sloučeniny podle vynálezu a jejich soli a kovové komplexy se vyznačují vynikající účinností proti široké paletě fytopatogenních hub, zejména z třídy Ascomycetes a Basidiomycetes. Popisované sloučeniny jsou zčásti systemicky účinné a lze je používat jako listové a půdní fungicidy.

Zvlášť zajímavá je použitelnost fungicidně účinných sloučenin k potírání četných hub na různých kulturních rostlinách nebo jejich semenech.

Kulturními rostlinami se v této souvislosti míní zejména pšenice, žito, ječmen, oves, rýže, kukuřice, bavlník, sója, kávovník, cukrová třtina, ovocné a okrasné rostliny v zahradní architektuře, jakož i zelenina, jako okurky, fazole, boby a tykvovité.

Popisované nové sloučeniny jsou zvlášť vhodné k boji proti následujícím chorobám rostlin:

Erysiphe graminis (padlí travní) na obilninách
Erysiphe cichoracearum (padlí řepné) na tykvovitých
Podosphaera leucotricha (padlí jabloňové) na jabloních
Uncinula necator (padlí révové) na révě vinné
Erysiphe polygoni (padlí rdesnové) na fazolích a bobech
Sphaerotheca pannosa (padlí) na růžích
druhy Puccinia (rez) na obilovinách
Rhizoctonia solani (kořenomorka bramborová) na bavlníku
druhy Helminthosporium (helminthosporióza) na obilovinách
druhy Ustilago (prašná sněť) na obilovinách a třtině cukrové
Rhynchosporium secale (rhynchosporiová skvrnitost) na obilovinách
Venturia inaequalis (strupovitost jabloní).

Ze sloučenin obecného vzorce I jsou fungicidně účinné zvláště ty, v nichž X_m představuje atom vodíku, atom chloru v poloze 4, dva atomy chloru v polohách 2 a 4, a trifluormetylovou skupinu v poloze 3.

Sloučeniny podle vynálezu se aplikují tak, že se rostliny účinnými látkami postříkají nebo popráší, nebo že se účinnými látkami ošetří semena rostlin. Aplikace se provádí před nebo po infikaci rostlin nebo semen houbou.

Účinné látky podle vynálezu je možno převádět na obvyklé prostředky, jako na roztoky, emulze, suspenze, popraše, práškové prostředky, pasty a granuláty. Aplikační formy se zcela řídí účely použití, v každém případě však mají zajistit jemné a rovnoměrné rozptýlení účinné látky. Tyto prostředky se připravují známým způsobem, například smísením účinné látky s rozpouštědly nebo/a nosnými látkami, popřípadě za použití emulgátorů a dispergátorů, přičemž v případě použití vody jako ředidla je možno používat jako pomocná rozpouštědla také organická rozpouštědla. Jako nosné látky a pomocné látky přicházejí přitom v úvahu hlavně: rozpouštědla, jako aromáty (například xylen nebo benzen), chlorované aromáty (například chlorbenzeny), parafiny (například ropné frakce), alkoholy (například metanol nebo butenol), aminy (například etanolamin), dimetylformamid a voda; nosné látky, jako přírodní kamenné moučky (například kaoliny, aluminy, mastek nebo křída) a syntetické kamenné moučky (např. vysoce disperzní kyselina křemičitá nebo křemičitany); emulgátory, jako neionogenní a aniontové emulgátory (například polyoxyetylenétery mastných alkoholů, alkylsulfonáty a arylsulfonáty) a dispergátory, jako lignin, sulfitové odpadní louhy a metylcelulóza.

Koncentráty obecně obsahují mezi 0,1 a 95 hmot. % účinné látky, s výhodou 0,5 až 90 hmot. % účinné látky.

Spotřeby účinných látek se, v závislosti na druhu požadovaného účinku, pohybují mezi 0,02 a 3 kg nebo více účinné látky na hektar.

Nové sloučeniny podle vynálezu je možno používat při ochraně materiálů, mj. k potírání hub ničících dřevo, jako jsou Coniophora puteana a Polystictus versicolor. Nové účinné látky je možno používat i jako fungicidně účinné složky olejových prostředků k ochraně dřeva proti houbám zbarvujícím dřevo. Aplikace se v daném případě provádí tak, že se dřevo těmito prostředky ošetří, například napustí nebo natře.

Koncentráty, popřípadě z nich připravené aplikovatelné prostředky, jako roztoky, emulze, suspenze, prášky, popraše, pasty nebo granuláty, se aplikují známým způsobem, například postřikem, zamlžováním, poprašováním, mořením nebo zálivkou.

Jako příklady výše zmíněných prostředků se uvádějí následující preparáty:

I. 90 hmotnostních dílů sloučeniny z příkladu 1 se smísí s 10 hmotnostními díly N-metyl-alfa-pyrrolidonu, čímž se získá roztok, který je vhodný k aplikaci ve formě co nejmenších kapiček.

II. 20 hmotnostních dílů sloučeniny z příkladu 2 se rozpustí ve směsi, která sestává z 80 hmotnostních dílů xylenu, 10 hmotnostních dílů adičního produktu 8 až 10 mol etylenoxidu na 1 mol N-monoetanolamidu kyseliny olejové, 5 hmotnostních dílů vápenaté soli kyseliny dodecylbenzensulfonové a 5 hmotnostních dílů adičního produktu 40 mol etylenoxidu na 1 mol ricinového oleje. Vylitím a jemným rozptýlením roztoku ve 100 000 hmotnostních dílech vody se získá vodná disperze, která obsahuje 0,02 hmotnostního % účinné látky.

III. 20 hmotnostních dílů sloučeniny z příkladu 3 se rozpustí ve směsi, která sestává ze 40 hmotnostních dílů cyklohexanonu, 30 hmotnostních dílů isobutanolu, 20 hmotnostních dílů adičního produktu 40 mol etylenoxidu na 1 mol ricinového oleje. Vylitím a jemným rozptýlením roztoku ve 100 000 hmotnostních dílech vody se získá vodná disperze, která obsahuje 0,02 hmotnostního % účinné látky.

IV. 20 hmotnostních dílů sloučeniny z příkladu 4 se rozpustí ve směsi, která sestává z 25 hmotnostních dílů cyklohexenolu, 65 hmotnostních dílů frakce minerálního oleje o teplotě varu 210 až 280 °C a 10 hmotnostních dílů adičního produktu 40 mol etylenoxidu na 1 mol ricinového oleje. Vylitím a jemným rozptýlením roztoku ve 100 000 hmotnostních dílech vody se získá vodná disperze, která obsahuje 0,02 hmotnostního % účinné látky.

V. 20 hmotnostních dílů účinné látky z příkladu 7 se dobře promísí se 3 hmotnostními díly sodné soli kyseliny diisobutylnaftalen-alfa-sulfonové, 17 hmotnostními díly sodné soli kyseliny ligninsulfonové z odpadních sulfitových louhů a 60 hmotnostními díly práškovitého silikagelu a získaná směs se rozemele v kladivovém mlýnu. Jemným rozptýlením směsi ve 20 000 hmotnostních dílech vody se získá postřiková suspenze, která obsahuje 0,1 hmotnostního % účinné látky.

VI. 3 hmotnostní díly sloučeniny z příkladu 2 se důkladně promísí s 97 hmotnostními díly jemně rozmělněného kaolinu. Tímto způsobem se získá popraš, která obsahuje 3 hmotnostní % účinné látky.

VII. 30 hmotnostních dílů sloučeniny z příkladu 1 se důkladně smísí se směsí 92 hmotnostních dílů práškovitého silikagelu a 8 hmotnostních dílů parafinového oleje, který byl nastříkán na povrch tohoto silikagelu. Tímto způsobem se získá účinný přípravek s dobrou přilnavostí.

VIII. 40 hmotnostních dílů účinné látky z příkladu 3 se důkladně promísí s 10 díly sodné soli kondenzačního produktu fenolsulfonové kyseliny, močoviny a formaldehydu, 2 díly silikagelu a 48 díly vody, čímž se získá stabilní vodná disperze. Zředěním této disperze 100 000 hmotnostními díly vody se připraví vodná disperze obsahující 0,04 hmotnostního % účinné látky.

IX. 20 dílů účinné látky z příkladu 4 se důkladně promísí s 2 díly vápenaté soli dodecylbenzensulfonové kyseliny, 8 díly polyglykoléteru mastného alkoholu, 2 díly sodné soli kondenzačního produktu fenolsulfonové kyseliny, močoviny a formaldehydu, a 68 díly parafinické frakce minerálního oleje, čímž se získá stabilní olejová disperze.

Účinné látky podle vynálezu mohou být v těchto aplikovatelných prostředcích obsaženy spolu s jinými účinnými látkami, jako například s herbicidy, insekticidy, regulátory růstu a fungicidy, nebo je lze také mísit s hnojivy a v této formě aplikovat. Při smísení s fungicidy se přitom v četných případech docílí rozšíření spektra účinnosti.

Následující přehled fungicidů, s nimiž je možno sloučeniny podle vynálezu kombinovat, blíže ilustruje tyto kombinační možnosti, v žádném případě je však nijak neomezuje.

Fungicidy, s nimiž je možno kombinovat sloučeniny podle vynálezu, jsou například

síra,
dithiokarbamáty a jejich deriváty, jako
dimetyldithiokarbamát železitý,
dimetyldithiokarbamát zinečnatý,
etylen-bis-dithiokarbamát manganatý,
etylendiamin-bis-dithiokarbamát manganatozinečnatý,
etylen-bis-dithiokarbamát zinečnatý,
tetrametylthiuramidsulfid,
amoniakální komplex N,N´-etylen-bis-dithiokarbamátu zinečnatého a N,N´-polyetylen-bis-(thiokarbamoyl)disulfidu,
N,N´-propylen-bis-dithiokarbamát zinečnatý,
amoniakální komplex N,N´-propylen-bis-dithiokarbamátu zinečnatého a N,N´-polypropylen-bis-(thiokarbamoyl)-disulfidu,

nitroderiváty, jako
dinitro-(1-metylheptyl)fenylkrotonát,
2-sek.butyl-4,6-dinitrofenyl-3,3-dimetylakrylát,
2-sek.butyl-4,6-dinitrofenyl-isopropylkarbonát;

heterocyklické sloučeniny, jako
N-(1,1,2,2-tetrachloretylthio)tetrahydroftalimid,
N-trichlormetylthio-tetrahydroftalimid,
N-trichlormetylthio-ftalimid,
2-heptadecyl-2-imidazolin-acetát,
2,4-dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin,
O,O-dietylftalimidofosfonothioát,
5-amino-1-[bis-(dimetylamino)fosfinyl]-3-fenyl-1,2,4-triazol,
5-etoxy-3-trichlormetyl-1,2,4-thiadiazol,
2,3-dikyan-1,4-dithiaantrachinon,
2-thio-1,3-dithio[4,5-b]chinoxalin,
metylester 1-butylkarbamoyl-2-benzimidazolkarbamové kyseliny,
2-metoxykarbonylaminobenzimidazol,
2-thiokyanatometylthiobenzthiazol,
4-(2-chlorfenylhydrazono)-3-metyl-5-isoxazolon,
pyridin-2-thiol-1-oxid,
8-hydroxychinolin nebo jeho měďnatá sůl,
2,3-dihydro-5-karboxanilido-6-metyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid,
2,3-dihydro-5-karboxanilido-6-metyl-1,4-oxathiin,
2-(2-furyl)benzimidazol,
piperazin-1,4-diyl-bis-[1-(2,2,2-trichloretyl)formamid],
2-(4-thiazolyl)benzimidazol,
5-butyl-2-dimetylamino-4-hydroxy-6-metylpyrimidin,
bis-(p-chlorfenyl)pyridinmetanol,
1,2-bis-(3-etoxykarbonyl-2-thioureido)benzen,
1,2-bis-(3-metoxykarbonyl-1-thioureido)benzen;

a různé další látky, jako
dodecylguanidinacetát,

3-[3-(3,5-dimetyl-2-hydroxycyklohexyl)-2-hydroxyetyl]glutarimid,
hexachlorbenzen,
N-dichlorfluormetylthio-N',N'-dimetyl-N-fenyldiamid kyseliny sírové,
2,5-dimetylfuran-3-karboxanilid,
cyklohexylamid 2,5-dimetylfuran-3-karboxylové kyseliny,
2-kyan-N-(etylaminokarbonyl)-2-(metoxyimino)acetamid,
anilid 2-metylbenzoové kyseliny,
anilid 2-jodbenzoové kyseliny,
1-(3,4-dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichloretan,
2,6-dimetyl-N-tridecylmorfolin a jeho soli,
2,6-dimetyl-N-cyklododecylmorfolin a jeho soli,
D,L-metyl-N-(2,6-dimetylfenyl)-N-2-furoylalaninát,
metylester D,L-N-(2,6-dimetylfenyl)-N-(2'-metoxyacetyl)anilinu,
diisopropylester 5-nitroisoftalové kyseliny,
1-(1',2',4'-triazol-1'-yl)-1-(4'-chlorfenoxy)-3,3-dimetylbutan-2-on,
1-(1',2',4'-triazol-1'-yl)-1-(4'-chlorfenoxy)-3,3-dimetylbutan-2-ol,
N-(2,6-dimetylfenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolakton,
N-(n-propyl)-N-(2,6-trichlorfenoxyetyl)-N'-imidazolylmočovina.

Fungicidní účinnost nových sloučenin dokládají následující příklady A až D. Jako srovnávací látka slouží preparát Imazalil, tj. 1-[2'-(2'',4'' -dichlorfenyl)-2'-(2''-propenyloxy)etyl]-1H-imidazol.

P ř í k l a d A

Účinnost proti padlí pšeničnému

Listy klíčních rostlin pšenice (druh "Jubilar"), pěstovaných v květináčích, se postříkají vodnými emulzemi obsahujícími v sušině 80 hmotnostních procent účinné látky a 20 % emulgátoru, a po oschnutí povlaku neneseného postřikem se popráší spórami (eidiemi) Erysiphe graminis var. tritici (padlí pšeničné). Pokusné rostliny se pak uchovávají ve skleníku při teplotě 20 až 22 °C a při 75 až 80% relativní vlhkosti vzduchu. Po 10 dnech se vyhodnotí rozsah napadení padlím.

Dosažené výsledky vyjadřované za pomoci stupnice 0 až 51, kde 0 znamená žádné napadení houbou a 5 představuje úplné napadení (stejné jako u kontrolních rostlin), jsou uvedeny v následující tabulce:

T a b u l k a A

Účinné látka (příklad č.)	Napadení listů po postřiku prostředkem obsahujícím účinnou látku v koncentraci (%)		
	0,025	0,006	0,0015
1	1	1	3
2	0	0	0
3	1	1	3 až 4
6	1	1	2
8	0	0	2 až 3
9	0	2	2
10	0	0	2
12	0	1	3
13	0	0	1
14	0	0	2 až 3
15	0	0	2
16	0	0	1

pokračování tabulky A

Účinná látka (příklad č.)	Napadení listů po postřiku prostředkem obsahujícím účinnou látku v koncentraci (%) 0,025	0,006	0,0015
17	0	0	0
18	0	0	2
19	0	0	0
21	0	1	2 až 3
23	0	0	1
26	0	2	3
27	1	1	2 až 3
28	0	0	2 až 3
29	1	2	3
30	1	2	2
31	1	2 až 3	3
36	1	2 až 3	3
38	1	2	2 až 3
42	1	2	2 až 3
44	0	2	3
46	1	1	2
47	0	2 až 3	3
53	2	2	3
55	1	2	3
59	1	1	2
65	1	1	3
67	0	0	3
69	0	0	3
71	2	1	2
Imazalil	2	4	5
kontrola (neošetřeno)	5		

P ř í k l a d B

Účinnost proti rzi pšeničné

Listy klíčních rostlin pšenice (druh "Caribo"), pěstovaných v květináčích, se popráší spórami houby Puccinia recondita (rez pšeničná). Květináče se pak 24 hodiny uchovávají při teplotě 20 až 22 °C v komoře s vysokou vlhkostí vzduchu (90 až 95 °C). Během této doby spóry vyklíčí a jejich klíčky proniknou do tkaniva listů. Infikované rostliny se pak do orosení postříkají vodnými suspenzemi o koncentraci 0,025, 0,006 a 0,0015 hmotnostních %, obsahujícími v sušině 80 % účinné látky a 20 % ligninsulfonátu. Po oschnutí povlaku naneseného postřikem se pokusné rostliny umístí do skleníku s teplotou 20 až 22 °C a 65 až 70% relativní vlhkostí vzduchu. Po 8 dnech se vyhodnotí napadení listů rzí.

Dosažené výsledky vyjadřované za pomoci stupnice 0 až 5, kde 0 znamená žádné napadení houbou a 6 představuje úplné napadení (stejné jako u kontrolních rostlin), jsou uvedeny v následující tabulce:

Tabulka B

Účinná látka (příklad č.)	Napadení listů po postřiku prostředkem obsahujícím účinnou látku v koncentraci (%)		
	0,025	0,006	0,0015
2	0	0	2
3	0	3	3
13	0	1	1
14	0	0	1
15	0	0	1
16	0	0	2
17	0	1	2 až 3
19	0	1	3
31	0	2	4
32	0	0	3 až 4
34	0	3	3 až 4
35	1	2	3
38	1	3	3 až 4
39	0	3	3 až 4
40	0	2	3 až 4
41	0	0	3
42	0	0	3
48	1	2 až 3	3
53	1	2	3 až 4
58	0	3	3 až 4
59	0	1	4
70	1	-	-
Imazalil	3	5	5
kontrola (neošetřeno)	5		

Příklad C

Účinnost proti Botrytis cinerea (plíseň šedá) na paprikách

Klíční rostliny papriky (odrůda "Neusiedler Ideal Elite") se poté, kdy se u nich dobře vyvinulo 4 až 5 listů, postříkají do orosení vodnou suspenzí obsahující v sušině 80 % účinné látky a 20 % emulgátoru. Po oschnutí povlaku naneseného postřikem se rostliny postříkají suspenzí konidií houby Botrytis cinerea a umístí se do komory s teplotou 22 až 24 °C a vysokou vlhkostí vzduchu. Po 5 dnech se na neošetřených kontrolních rostlinách rozvine choroba do té míry, že převážná část listů je pokryta nekrotickými skvrnami.

Dosažené výsledky, vyjadřované za pomoci stupnice od 0 do 5, kde 0 znamená žádné napadení houbou a 5 představuje úplné napadení (stejné jako u kontrolních rostlin), jsou uvedeny v následující tabulce:

Tabulka C

Účinná látka (příklad č.)	Napadení listů po postřiku prostředkem obsahujícím účinnou látku v koncentraci 0,05 %
1	1
2	0
13	0
15	2
16	2
17	1
23	1
53	0
55	0
58	1
59	1
61	0
neošetřeno	5

Příklad D

Účinnost proti Venturia inaequalis (strupovitost jabloní)

Mladé listy jabloňových semenáčků (půdůda "Golden Delicious"), pěstovaných v květináčích, se až do orosení postříkají vodnou suspenzí obsahující v sušině 80 % účinné látky a 20 % emulgátoru. Po oschnutí povlaku naneseného postřikem se pokusné rostliny postříkají suspenzí spór houby Venturia inaequalis a inokulované rostliny se na 10 dnů umístí do klimatizované komory s teplotou 20 až 22 °C a 95% relativní vlhkostí vzduchu. Po této době se vyhodnotí rozsah výskytu houby na listech.

Dosažené výsledky vyjadřované za pomoci stupnice 0 až 5, kde 0 znamená žádné napadení houbou a 5 představuje úplné napadení (stejné jako u kontrolních rostlin), jsou uvedeny v následující tabulce:

Tabulka D

Účinná látka (příklad č.)	Napadení listů po postřiku prostředkem obsahujícím 0,0075 % účinné látky
1	0
2	0
53	0
55	1
74	0
75	1
neošetřeno	5

Nové účinné látky podle vynálezu zasahují rovněž do metabolismu rostlin a lze je proto používat jako regulátory růstu.

Pro mechanismus účinku regulátorů růstu rostlin platí podle dosavadních zkušeností, že účinná látka může na rostliny působit jedním nebo také několika různými účinky.

Mnohotvárnost účinků regulátorů růstu rostlin závisí především

a) na druhu a kultivaru rostliny,

b) na době aplikace, vztaženo na vývojové stadium rostliny, a na roční době,

c) na místě a způsobu aplikace (moření semen, ošetření půdy, listové aplikace),

d) na geoklimatických faktorech, např. na době slunečního svitu, na průměrné teplotě a na množství srážek,

e) na stavu půdy (včetně hnojení),

f) na účinném prostředku, popřípadě na aplikační formě účinné látky a

g) na použité koncentraci, popřípadě spotřebě účinné látky.

V každém případě mají regulátory růstu pozitivně ovlivnit kulturní rostliny žádoucím způsobem.

V následující části se z celé řady nejrůznějších možností použití regulátorů růstu podle vynálezu v rostlinné výrobě, v zemědělství a zahradnictví uvádí několik takovýchto aplikací.

A. Sloučeninami podle vynálezu je možno silně zbrzdit vegetativní růst rostlin, což se projevuje zejména potlačením růstu do délky. Ošetřené rostliny mají tedy zakrslý vzrůst a mimoto je možno pozorovat rovněž tmavší zbarvení listů.

Pro praxi se jako výhodné ukázalo například potlačení růstu trávy na okrajích cest a silnic, na svazích kanálů a na zatravněných plochách, jako jsou parky, sportoviště a ovocné sady, okrasné trávníky a letištní plochy, jímž je možno snížit pracovní i finanční náklady na kosení, resp. stříhání trávy.

Z hospodářského hlediska je rovněž zajímavé zvýšení odolnosti proti poléhání u kultur náchylných k poléhání, jako jsou obiloviny, kukuřice, slunečnice a sója. Zkrácením a zesílením stébel, jehož se docílí působením sloučenin podle vynálezu, se sníží nebo úplně odstraní nebezpečí poléhání rostlin za nepříznivých povětrnostních podmínek před sklizní.

Důležité je rovněž použití regulátorů růstu k zbrzdění délkového růstu a k časovým změnám průběhu zrání u bavlníku. Tímto způsobem se umožní úplná mechanizace sklizně této důležité kulturní plodiny.

Použitím regulátorů růstu lze rovněž zbrzdit nebo naopak podpořit růst postranních výhonů, resp. zvýšit jejich počet. Toto je zvláště důležité například u rostlin tabáku, má-li se potlačit vývoj postranních výhonů ve prospěch růstu listů.

Další mechanismus zvýšení výnosů pomocí látek zpomalujících růst spočívá v tom, že se živiny ve větší míře využijí k tvorbě květů a plodů, zatímco vegetativní růst je omezen. V tomto případě je dále možno, v důsledku relativně nižší hmotnosti listů, resp. rostlin, zabránit napadení různými, zejména houbovými chorobami.

Pomocí látek zpomalujících růst je možno například u ozimé řepky rovněž značně zvýšit odolnost proti mrazu. V daném případě se na jedné straně potlačí růst do délky a vývoj pří-

liš bujné (a tím na mráz zvlášť citlivé) listové, resp. rostlinné hmoty. Naproti tomu se mladé rostliny řepky po zasetí a před nástupem zimních mrazů přes příznivější růstové podmínky uchovávají ve vegetativním vývojovém stadiu. Tímto způsobem se rovněž odstraní ohrožení mrazem u těch rostlin, které mají sklon k předčasnému vykvétání a k přechodu na generativní fázi. I u jiných kultur, například u ozimých obilovin, je výhodné, pokud porosty v důsledku ošetření sloučeninami podle vynálezu na podzim sice dobře odnoží, ale pokud nevstupují do zimního období příliš bujně vzrostlé. Tím je možno odstranit zvýšenou citlivost na mráz a, v důsledku poměrně nízké hmotnosti listů a rostlin, předejít napadení různými chorobami (například houbovými chorobami).

Potlačení vegetativního růstu mimoto u četných kulturních rostlin umožňuje hustší výsev nebo vysazování, čímž je možno docílit zvýšení výnosů na jednotku plochy. Sloučeniny podle vynálezu se zvlášť hodí k potlačení vegetativního růstu širokého spektra kulturních rostlin, jako pšenice, žita, ovsa, kukuřice, slunečnice, podzemnice olejné, rajčat, různých okrasných rostlin, jako chryzantém, poinsetií a ibišků, bavlníku a zejména sóji, řepky, ječmene, rýže a trav.

B. Pomocí nových účinných látek je možno docílit vyšších výnosů jak částí rostlin, tak i obsahových látek rostlin. Tak je například možno indukovat růst většího počtu pupenů, květů, listů, plodů, semen, kořenů a hlíz, zvyšovat obsah cukru v cukrové řepě, cukrové třtině a citrusech, zvyšovat obsah proteinů v obilovinách nebo v sóji, nebo stimulovat výtok latexu u kaučukovníků.

Nové sloučeniny přitom mohou zvyšovat výnosy tím, že zasahují do látkové výměny rostlin, popřípadě napomáhají nebo brzdí vegetativní nebo/a generativní růst.

C. Konečně je možno pomocí regulátorů růstu rostlin dosáhnout jak zkrácení, popřípadě prodloužení růstových stadií, tak i urychlení, popřípadě zpoždění dozrávání sklízených částí rostlin před nebo po sklizni.

Hospodářsky zajímavé je například usnadnění sklizňových prací, které je umožněno tím, že se do určitého časového údobí zkoncentruje opadávání plodů nebo se zmenší síla nutná k odtržení plodů ze stromů v případě citrusovníků, olivovníků nebo jiných druhů s odrůd jádrového, peckového a skořápkového ovoce. Stejný mechanismus, tj. stimulace tvorby dělicí tkáně mezi plodem, popřípadě listem, a stonkem rostliny je rovněž důležitý pro dobře kontrolovatelné odlistění stromů.

Účinné látky je možno do kulturních rostlin přivádět jak prostřednictvím semen (tj. při aplikaci těchto látek jako mořidel osiva), tak i prostřednictvím půdy (tj. pomocí kořenů), jakož i, a to zvlášť výhodně, aplikací postřikem na list.

V důsledku vysoké snášitelnosti pro rostliny se mohou spotřeby účinných látek měnit v širokých mezích.

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

Při aplikaci na list a při ošetřování půdy lze obecně vystačit s dávkami 0,001 až 12 kg/ha, s výhodou 0,01 až 3 kg/ha.

Při použití k regulování růstu rostlin je možno sloučeniny podle vynálezu zpracovávat na obvyklé prostředky, které odpovídají prostředkům uvedeným výše u popisu použití sloučenin podle vynálezu jako fungicidů. Takto získané prostředky, popřípadě z nich připravené přímo použitelné preparáty, jako roztoky, emulze, suspenze, prášky, popraše, pasty nebo granuláty, se aplikují známým způsobem, například preemergentně, postemergentně nebo jako mořidla.

Látky podle vynálezu, regulující růst rostlin, mohou být v těchto prostředcích rovněž obsaženy společně s dalšími účinnými látkami, jako například herbicidy, insekticidy, regulátory růstu rostlin a fungicidy, nebo je lze mísit se strojenými hnojivy a v této formě aplikovat. Při mísení s regulátory růstu se přitom v četných případech dosáhne rozšíření spektra účinnosti, a v určitých případech dochází u těchto směsí rovněž k synergickému účinku, tzn., že účinnost kombinovaného produktu je vyšší než pouhý součet účinností jednotlivých komponent.

Jako regulátory růstu rostlin jsou ze sloučenin obecného vzorce I výhodné ty, v nichž n je celé číslo o hodnotě 2 nebo 3, zejména 2, Z znamená atom dusíku a Y představuje skupinu CO nebo CHOH.

K stanovení účinnosti testovaných sloučenin na regulaci růstu rostlin se pokusné rostliny pěstují v květináčích z plastické hmoty (průměr cca 12,5 cm), naplněných substrátem s dostatečným množstvím živin.

Při preemergentním testu se testované látky ve formě vodného prostředku aplikují na jednotlivé řádky tentýž den, kdy se provádí výsev.

Při postemergentním testu se testovanými sloučeninami ve formě vodných prostředků postříkají pokusné rostliny. Účinek na regulování růstu rostlin se zjišťuje po ukončení testu měřením růstu do výšky. Takto zjištěné hodnoty se porovnávají s hodnotami dosaženými u neošetřených rostlin. Jako srovnávací látky se používají 3-(1,2,4-triazol-1-yl)-1-(4-chlorfenyl)-4,4-dimetylpentan-1-on (A) (DOS č. 2 739 352), popřípadě (2-chloretyl)trimetylamoniumchlorid (CCC).

Výsledky dosažené při těchto testech na různých pokusných rostlinách jsou uvedeny v následujících tabulkách E až K.

T a b u l k a E

Účinnost na jarní ječmen "Union" při preemergentní aplikaci

Účinná látka (příklad č.)	Dávka účinné látky (mg/květináč)	Růst do výšky (%)
CCC	3	89,6
A	12	77,7
	3	93,6
	12	67,7
6	3	67,7
	12	47,8
9	3	87,7
	12	75,7
13	3	79,9
	12	72,2
23	3	84,9
	12	53,5
28	3	78,6
	12	53,5
67	3	86,7
	12	53,3
69	3	80,0
	12	35,0
neošetřeno		100

T a b u l k a F

Účinnost na rýži "Gerona" při postemergentní aplikaci

Účinná látka (příklad č.)	Dávka účinné látky (mg/květináč)	Růst do výšky (%)
CCC	1,5	101,2
	6,0	97,3
A	1,5	101,2
	6,0	101,2
5	1,5	85,6
	6,0	85,6
6	1,5	66,9
	6,0	63,0
67	1,5	89,5
	6,0	88,0
69	1,5	89,5
	6,0	86,5
79	1,5	91,6
	6,0	85,6
80	1,5	93,1
	6,0	90,1
neošetřeno		100

T a b u l k a G

Účinnost na trávu při postemergentní aplikaci

Účinná látka (příklad č.)	Dávka účinné látky (mg/květináč)	Růst do výšky (%)
CCC	1,5	98,9
	6,0	98,9
A	1,5	101,3
	6,0	97,2
6	1,5	82,4
	6,0	60,4
26	1,5	67,6
	6,0	49,5
28	1,5	49,5
	6,0	31,5
67	1,5	89,6
	6,0	66,0
neošetřeno		100

T a b u l k a H

Účinnost na jarní řepku "Petranova" při preemergentní aplikaci

Účinná látka (příklad č.)	Dávka účinné látky (mg/květináč)	Růst do výšky (%)
CCC	3	92,9
	12	88,5
A	3	82,9
	12	73,2
5	3	75,2
	12	64,2
6	3	53,7
	12	19,5
9	3	73,2
	12	34,2
13	3	39,2
	12	19,6
19	3	71,1
	12	46,6
23	3	71,1
	12	36,8
24	3	70,8
	12	53,1
26	3	62,0
	12	50,9
28	3	44,3
	12	17,7
30	3	70,8
	12	62,0
67	3	47,7
	12	28,4
69	3	47,4
	12	19,0
71	3	66,4
	12	40,3
73	3	66,4
	12	40,3
79	3	40,9
	12	24,2
80	3	81,8
	12	48,3
neošetřeno		100

T a b u l k a I

Účinnost na jarní řepku "Petrenova" při postemergentní aplikaci

Účinná látka (příklad č.)	Dávka účinné látky (mg/květináč)	Růst do výšky (%)
CCC	1,5	88,4
	6,0	88,4
A	1,5	93,0
	6,0	93,0
1	1,5	86,1
	6,0	79,1
5	1,5	88,0
	6,0	83,3
9	1,5	76,6
	6,0	74,2
11	1,5	83,7
	6,0	76,6
13	1,5	79,1
	6,0	74,4
14	1,5	97,7
	6,0	74,4
16	1,5	88,4
	6,0	79,1
23	1,5	88,4
	6,0	79,1
24	1,5	85,7
	6,0	78,7
25	1,5	83,3
	6,0	78,7
26	1,5	83,3
	6,0	67,1
27	1,5	88,0
	6,0	69,4
28	1,5	78,7
	6,0	67,1
29	1,5	78,7
	6,0	67,1
30	1,5	83,3
	6,0	69,4
31	1,5	74,1
	6,0	62,5
32	1,5	69,4
	6,0	67,1
33	1,5	83,0
	6,0	74,7
38	1,5	85,1
	6,0	72,6

pokračování tabulky I

Účinná látka (příklad č.)	Dávka účinné látky (mg/květináč)	Růst do výšky (%)
41	1,5	83,0
	6,0	62,2
67	1,5	72,8
	6,0	56,3
69	1,5	79,8
	6,0	54,0
71	1,5	68,1
	6,0	68,1
73	1,5	77,5
	6,0	72,8
79	1,5	90,6
	6,0	70,9
80	1,5	86,6
	6,0	63,0
neošetřeno		100

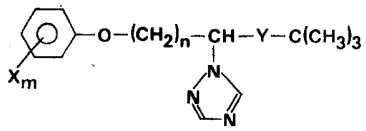
T a b u l k a K

Účinnost na sóju "Gieso" při postemergentní aplikaci

Účinná látka (příklad č.)	Dávka účinné látky (mg/květináč)	Růst do výšky (%)
CCC	0,5	99,3
	1,5	94,9
6	0,5	66,2
	1,5	65,5
9	0,5	64,0
	1,5	62,9
10	0,5	77,3
	1,5	64,0
11	0,5	66,2
	1,5	64,0
neošetřeno		100

P Ř E D M Ě T V Y N Á L E Z U

Fungicidní prostředek a prostředek k regulaci růstu rostlin, vyznačující se tím, že obsahuje pevný nebo kapalný nosič a jako účinnou látku azolylderivát obecného vzorce I



ve kterém

X znamená atom vodíku, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, trifluormetylovou skupinu nebo fenylovou skupinu a m je celé číslo o hodnotě 1 a 2, přičemž v případě, že m má hodnotu 2, mohou být jednotlivé zbytky ve významu symbolu X stejné nebo rozdílné,

n je celé číslo o hodnotě 2 až 5 a

Y znamená skupinu CO nebo seskupení vzorce CR^1OR^2, kde R^1 představuje atom vodíku nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a R^2 představuje atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 3 až 4 atomy uhlíku nebo alkinylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku,

nebo jeho pro rostliny snášitelnou adiční sůl s kyselinou nebo jeho kovový komplex.