

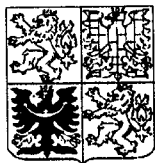
PATENTOVÝ SPIS

(11) Číslo dokumentu:

283 597

(19)

ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: **1609-88**

(22) Přihlášeno: **11. 03. 88**

(30) Právo přednosti:

13. 03. 87 JP 87/58451
03. 04. 87 JP 87/82546
30. 04. 87 JP 87/106577

(40) Zveřejněno: **18. 02. 98**

(Věstník č. 2/98)

(47) Uděleno: **10. 03. 98**

(24) Oznámeno udělení ve Věstníku: **13. 05. 98**

(Věstník č. 5/98)

(13) Druh dokumentu: **B6**

(51) Int. Cl.⁶:

A 01 N 43/50
A 01 N 43/08
A 01 N 43/84
A 01 N 37/30
A 01 N 37/34
A 01 N 33/00
A 01 N 31/14

(73) Majitel patentu:

ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD., Osaka,
JP;

(72) Původce vynálezu:

Nasu Rikuo, Kusatsu-shi, JP;
Komyoji Terumasa, Kasutsu-shi, JP;
Suzuki Kazumi, Kasutsu-shi, JP;
Nakajima Toshio, Kusatsu-shi, JP;
Ito Keichiro, Kusatsu-shi, JP;
Ohshima Takeshi, Kusatsu-shi, JP;
Yoshimura Hideshi, Kusatsu-shi, JP;

(74) Zástupce:

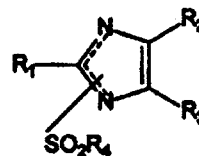
Hořejš Milan JUDr. ing., Národní třída 32,
Praha 1, 11666;

(54) Název vynálezu:

**Insekticidní, akaricidní a fungicidní
prostředek**

(57) Anotace:

Insekticidní, akaricidní a fungicidní prostředek pro potírání škodlivých organismů, který obsahuje jako účinnou složku 0,05 až 90 dílů hmotnostních imidazolového derivátu obecného vzorce I, kde jednotlivé symboly mají význam převážně organických zbytků a 10 až 99,95 dílů hmotnostního alespoň jednoho zemědělsky přijatelného nosiče nebo pomocné látky.



(I)

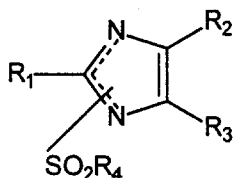
CZ 283 597 B6

Insekticidní, akaricidní a fungicidní prostředekOblast techniky

Vynález se týká insekticidního, akaricidního a fungicidního prostředku.

Podstata vynálezu

Předmětem vynálezu je insekticidní, akaricidní a fungicidní prostředek pro potírání škodlivých organismů, jehož podstata spočívá v tom, že jako účinnou složku obsahuje 0,05 až 90 dílů hmotnostních imidazolového derivátu obecného vzorce I



(I)

ve kterém

- R₁ představuje kyanoskupinu nebo zbytek vzorce –CSNHR₅, kde R₅ znamená atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo zbytek vzorce –COR₆, ve kterém R₆ představuje alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;
- R₂ představuje atom vodíku; cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku; naftylskupinu; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku; alkylnskupinu se 7 až 12 atomy uhlíku; alkylnskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituovaná jedním atomem halogenu, jednou hydroxyskupinou nebo jednou alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku; alkylnskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituovaná jednou nebo dvěma fenylskupinami; alkylnskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituovaná jednou hydroxyskupinou a jednou fenylskupinou; alkylnskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituována jednou monohalogenovanou fenylskupinou nebo jednou alkylovanou fenylskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části; halogenovanou alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; alkoxykarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části; alkenylskupinu se 2 až 6 atomy uhlíku; fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo dvěma atomy halogenu, alkylnskupinami s 1 až 4 atomy uhlíku a/nebo alkoxykupinami s 1 až 4 atomy uhlíku; fenylskupinu, která je substituována jednou halogenovanou alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, jednou nitroskupinou nebo jednou kyanoskupinou; fenylskupinu, která je substituována jednou 3,4-methylenedioxykupinou; furylskupinu, která je popřípadě substituována jednou alkylnskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku; thienylskupinu, která je popřípadě substituována jedním atomem halogenu; skupinu obecného vzorce –SR₇, kde R₇ představuje alkylnskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenylskupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, benzylskupinu nebo fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním atomem halogenu; skupinu –SR₇, kde R₇ představuje pyridylskupinu, která je popřípadě substituována trifluormethylskupinou; nebo skupinu obecného vzorce –SO₂R₈, kde R₈ představuje alkylnskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; skupinu –SO₂N(R₉)₂, kde R₉ představuje alkylnskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; nebo skupinu –CONHR₁₀, kde R₁₀ představuje fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním atomem halogenu;

R₃ představuje atom vodíku; atom halogenu; kyanoskupinu; nitroskupinu; alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; fenylthioskupinu; fenylskupinu; furylskupinu; nebo halogenovanou alkylkarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku a

R₄ představuje alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku nebo skupinu obecného vzorce $-NR_{11}R_{12}$, kde každý ze symbolů R₁₁ a R₁₂ představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo R₁₁ a R₁₂ společně, dohromady s přilehlým atomem dusíku, představují morfolinoskupinu;

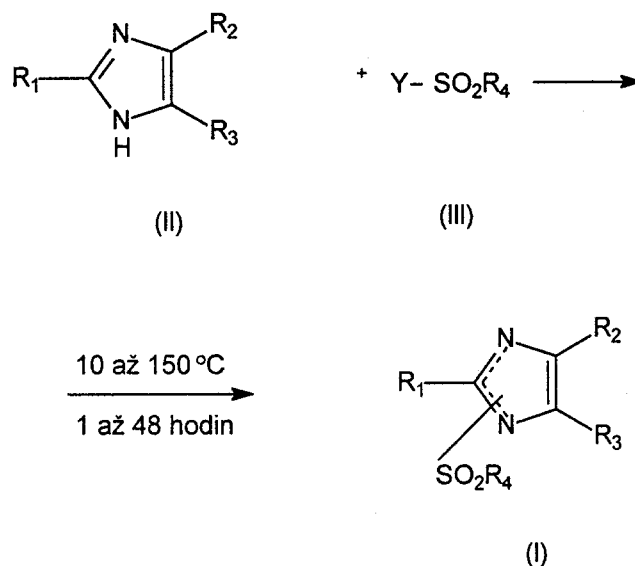
a 10 až 99,95 dílu hmotnostního alespoň jednoho zemědělsky přijatelného nosiče nebo pomocné látky.

V dalším textu jsou také popsány způsob výroby imidazolových derivátů obecného vzorce I a meziprodukty pro tento způsob.

Alkylové skupiny s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylové části alkoxykupin s 1 až 4 atomy uhlíku a alkylové části alkylthioskupin s 1 až 4 atomy uhlíku ve sloučeninách shora uvedeného obecného vzorce I mohou zahrnovat methylovou, ethylovou; n-propylovou, isopropylovou, n-butylovou, sek.butylovou, isobutylovou a terc.butylovou skupinu. Alkylové skupiny s 1 až 6 atomy uhlíku mohou kromě shora uvedených alkylových skupin s 1 až 4 atomy uhlíku zahrnovat ještě skupinu n-pentylovou a n-hexylovou. Kromě příkladů uvedených výše pro alkylové skupiny s 1 až 6 atomy uhlíku mohou alkylkové skupiny s 1 až 12 atomy uhlíku zahrnovat ještě skupinu heptylovou, oktylovou, nonylovou a decylovou. Cykloalkylovými skupinami se 3 až 6 atomy uhlíku mohou být skupiny cyklopropylová, cyklobutylová, cyklopentylová a cyklohexylová. Do definice alkenylových skupin se 2 až 4 atomy uhlíku může náležet allylová skupina apod. Kromě příkladů uvedených výše pro alkenylové skupiny se 2 až 4 atomy uhlíku mohou alkenylové skupiny se 2 až 6 atomy uhlíku zahrnovat ještě pentylovou skupinu apod. Alkenylové skupiny se 2 až 10 atomy uhlíku mohou kromě shora uvedených příkladů alkenylových skupin se 2 až 6 atomy uhlíku zahrnovat ještě geranylovou skupinu apod. Atomy halogenů mohou být atomy chloru, bromu, fluoru a jodu.

Nové imidazolové deriváty shora uvedeného obecného vzorce I je možno konkrétněji vyrobit postupem podle následujícího reakčního schématu:

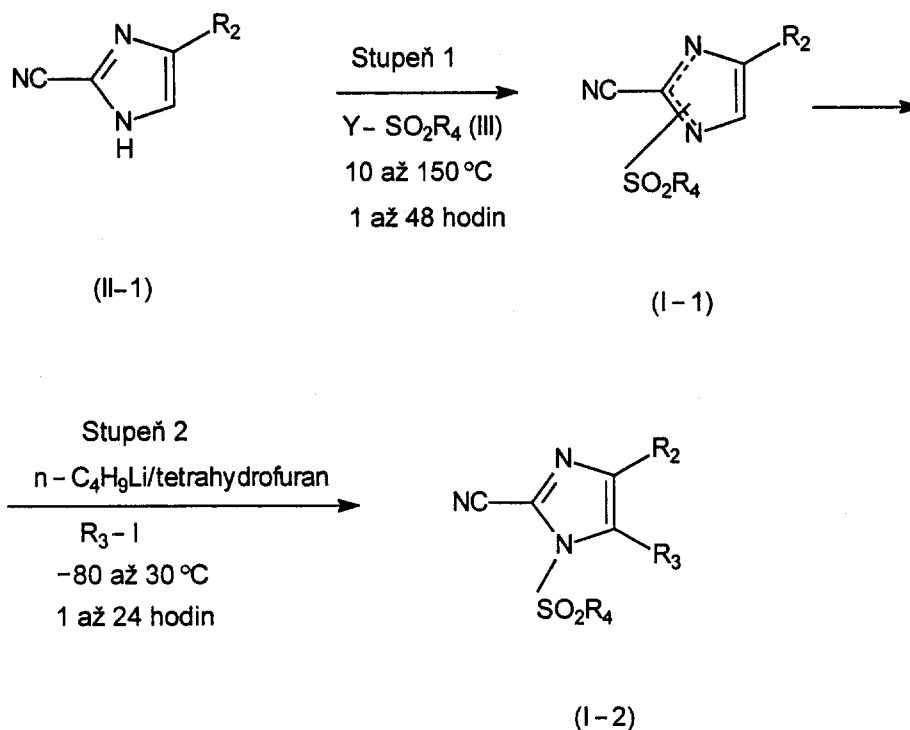
Schéma A



Ve vzorcích uvedených v tomto schématu mají symboly R_1 , R_2 , R_3 a R_4 shora uvedený význam a Y představuje atom halogenu.

Sloučeniny shora uvedeného obecného vzorce I, ve kterém R_1 znamená kyanoskupinu, lze rovněž připravit postupem podle následujícího reakčního schématu:

Schéma B

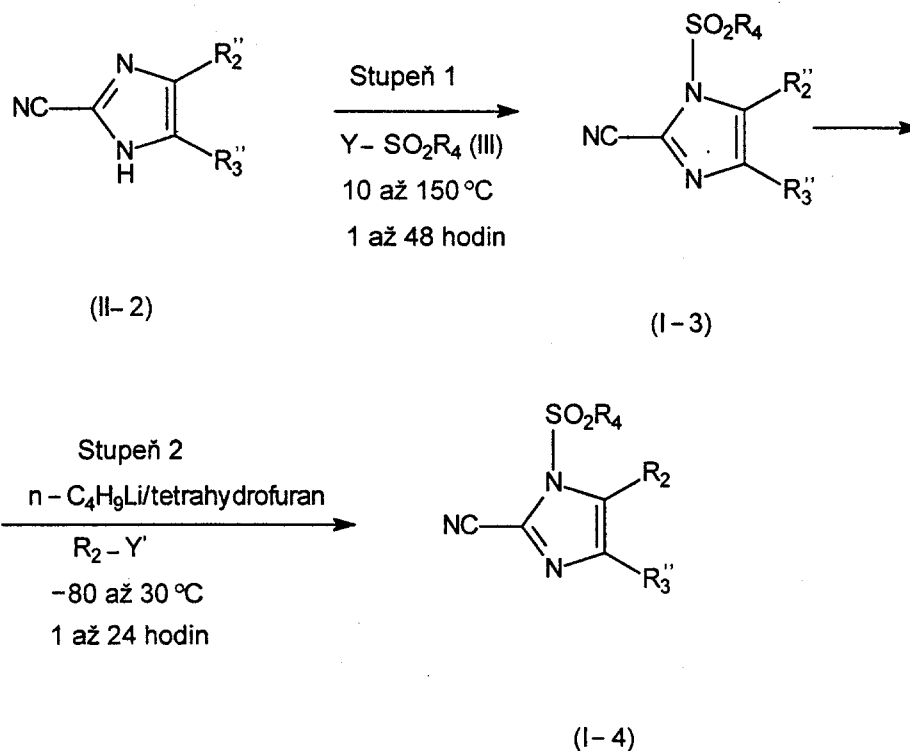


Ve vzorcích uvedených v tomto schématu mají symboly R_2 , R_3 , R_4 , R_7 a Y shora uvedený význam.

K výrobě sloučeniny shora uvedeného obecného vzorce I-2, v němž R_3 představuje skupinu $-SR_7$, lze ve stupni 2 postupu B použít namísto sloučeniny R_3-I sloučeninu obecného vzorce R_7SSR_7 .

Ty sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém R_1 znamená kyanoskupinu a R_3 představuje atom vodíku, chloru nebo bromu, lze rovněž připravit postupem podle následujícího reakčního schématu:

Schéma C

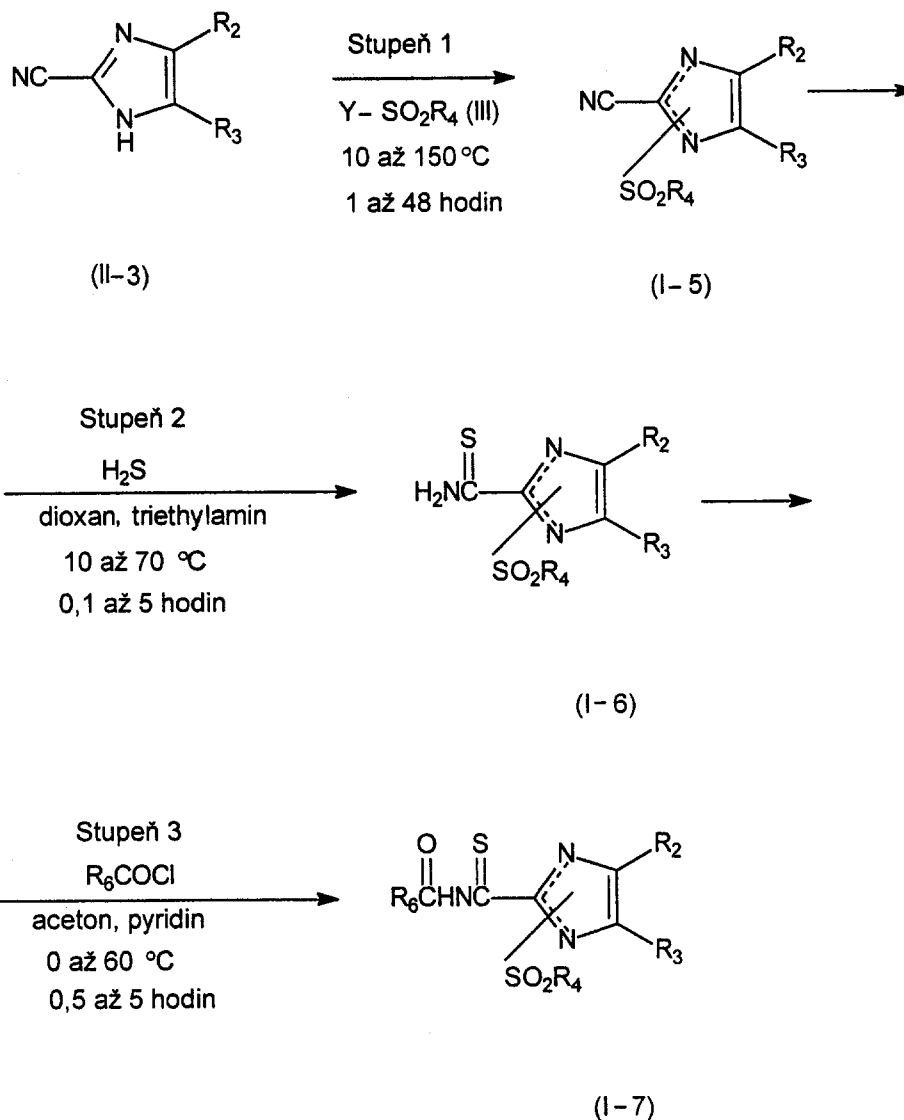


Ve vzorcích uvedených v tomto reakčním schématu mají symboly R_2 , R_4 a R_7 shora uvedený význam, R''_2 a R''_3 znamenají současně atom vodíku, atom chloru nebo atom bromu a Y' představuje atom chloru, bromu nebo jodu.

K výrobě sloučenin shora uvedeného obecného vzorce I-4, v němž R_2 představuje skupinu $-\text{SR}_7$, lze ve stupni 2 postupu C použít namísto sloučeniny $R_2\text{-Y}'$ sloučeninu obecného vzorce $R_7\text{SSR}_7$ a k výrobě sloučenin, v nichž R_2 představuje skupinu $-\text{CH}(\text{OH})\text{-R}_{13}$, kde R_{13} znamená alkylovou skupinu nebo popřípadě substituovanou fenylovou skupinu, lze ve stupni 2 postupu C použít namísto sloučeniny $R_2\text{-Y}'$ sloučeninu obecného vzorce $R_{13}\text{-CHO}$.

Sloučeniny shora uvedeného obecného vzorce I, ve kterém R_1 představuje skupinu $-\text{CSNH}_2$ nebo $-\text{CSNHCOR}_6$, lze připravit rovněž postupem podle následujícího reakčního schématu:

Schéma D



Ve vzorcích uvedených v tomto schématu mají R_2 , R_3 , R_4 , R_6 a Y shora uvedený význam.

Postup A a stupně 1 postupů B až D se podle potřeby popřípadě provádějí v přítomnosti rozpouštědla a akceptoru kyseliny.

Jako příklady vhodných rozpouštědel lze uvést aromatické uhlovodíky, jako benzen, toluen, xylén, chlorbenzen apod., cyklické nebo acyklické alifatické uhlovodíky, jako chloroform, tetrachlormethan, methylenchlorid, dichlorethan, trichlorethan, *n*-hexan, cyklohexan apod., ethery, jako diethylether, dioxan, tetrahydrofuran apod., ketony, jako aceton, methylethylketon, methylisobutylketon apod., nitrily, jako acetonitril, propionitril apod., a aprotická polární rozpouštědla, jako dimethylformamid, *N*-methylpyrrolidon, dimethylsulfoxid, sulfolan apod.

Jako akceptor kyseliny je možno použít libovolnou anorganickou nebo organickou bázi. Jako příklady vhodných anorganickýchází lze uvést hydroxidy alkalických kovů, jako hydroxid

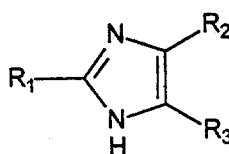
sodný, hydroxid draselný apod., uhličitany alkalických kovů a kovů alkalických zemin, jako bezvodý uhličitán draselný, bezvodý uhličitán vápenatý apod., hydridy alkalických kovů, jako natriumhydrid, alkalické kovy, jako kovový sodík apod., z vhodných organických bází lze jmenovat trimetylamín apod.

Shora popsané reakce je možno provádět v přítomnosti vhodného katalyzátoru. Jako příklady takovýchto katalyzátorů lze uvést katalyzátory fázového přenosu, jako kvartérní amoniové deriváty.

Jako atomy halogenů ve významu symbolu Y ve shora uvedeném obecném vzorci III lze jmenovat atom chloru, atom bromu, atom jodu a atom fluoru, přičemž výhodným halogenem je chlor.

Typické příklady meziproduktů obecného vzorce II, používaných pro výrobu imidazolových derivátů obecného vzorce I podle vynálezu, jsou shrnuty do následující tabulky 1.

Tabulka 1



(II)

meziprodukt č.	R ₁	R ₂	R ₃	teplota tání (°C)
1	CN	Br	H	196 až 201
2	CN	3-trifluormethylfenyl	H	160 až 168
3	CN	Cl	CH ₃	194 až 196
4	CN	4-methoxyfenyl	Cl	150 až 155
5	CN	fenyl	CH ₃	222 až 225
6	CN	fenyl	Br	120 až 125
7	CN	4-fluorfenyl	H	211 až 213
8	CN	4-methylfenyl	H	228 až 232
9	CN	4-methylfenyl	Br	142 až 144
10	CN	4-fluorfenyl	Br	176 až 178
11	CN	3,4-dichlorfenyl	H	115 až 121
12	CN	4-methylfenyl	Cl	124 až 129
13	CN	Cl	H	150 až 153
14	CN	n-C ₃ H ₇	Cl	107 až 109
15	CN	fenyl	Cl	149 až 151
16	CN	3-methylfenyl	Cl	140 až 142
17	CN	3,4-dimethylfenyl	Cl	150 až 152
18	CN	4-fluorfenyl	Cl	153 až 155
19	CN	4-bromfenyl	Cl	162 až 167
20	CN	4-ethylfenyl	Cl	141 až 145
21	CN	4-ethylfenyl	H	214 až 217
22	CN	3-methoxyfenyl	H	218 až 220
23	CN	4-nitrofenyl	H	230 až 235
24	CN	5-chlor-2-thienyl	H	202 až 206

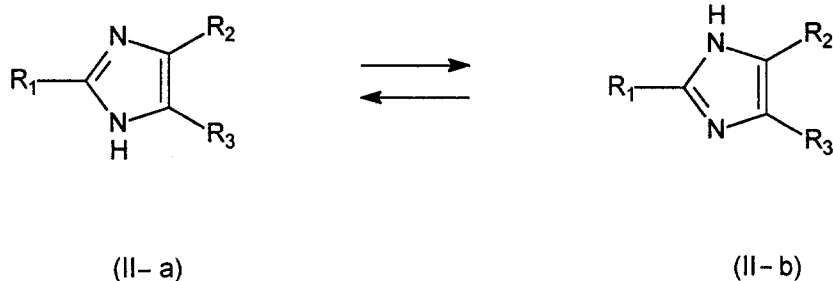
Tabulka 1 - pokračování

meziprodukt č.	R ₁	R ₂	R ₃	teplota tání (°C)
25	CN	SCH ₃	H	
26	CN	fenylthio	H	166 až 169
27	CN	fenyl	CN	207 až 215
28	CN	H	F	
29	CN	2-naftyl	Cl	146 až 149
30	CN	2-naftyl	H	253 až 255
31	CN	4-nitrofenyl	Cl	189 až 191
32	CN	4-chlorfenyl	H	215 až 224
33	CN	4-chlorfenyl	Cl	178 až 181
34	CN	2-chlorfenyl	Cl	145 až 152
35	CN	2-chlorfenyl	Br	152 až 156
36	CN	4-isopropylfenyl	H	180 až 184
37	CN	4-methylthiofenyl	H	217 až 219
38	CN	4-(2',2',2'-trifluorethoxy)fenyl	H	195 až 198
39	CN	CH ₃	NO ₂	125 až 130
40	CN	terc.C ₄ H ₉	Br	120 až 127
41	CN	2-methylfenyl	H	
42	CN	2-methylfenyl	Cl	
43	CN	5-methyl-2-furyl	H	169 až 171
44	CN	3,4-dimethoxyfenyl	H	188 až 190
45	CN	4-ethoxyfenyl	H	218 až 219
46	CN	3-methyl-4-methoxyfenyl	H	199 až 205
47	CN	2-thienyl	H	195 až 203
48	CN	4-(2',2',2'-trifluorethoxy)fenyl	Cl	164 až 166
49	CN	4-(2',2',2'-trifluorethoxy)fenyl	Br	150 až 155
50	CN	3-methyl-4-methoxyfenyl	Cl	145 až 149
51	CN	3-chlor-4-methylfenyl	Br	190 až 194
52	CN	CH ₃	CN	142 až 145
53	CN	C ₂ H ₅	H	127 až 129
54	CN	C ₂ H ₅	Cl	138 až 140
55	CN	n-C ₃ H ₇	H	52 až 54
56	CN	n-C ₃ H ₇	I	106 až 109
57	CN	n-C ₄ H ₉	H	83 až 85
58	CN	n-C ₄ H ₉	Cl	107 až 109
59	CN	n-C ₅ H ₁₁	H	89 až 92
60	CN	n-C ₅ H ₁₁	Cl	109 až 110
61	CN	iso-C ₃ H ₇	H	88 až 91
62	CN	iso-C ₃ H ₇	Cl	84 až 87
63	CN	iso-C ₄ H ₉	H	
64	CN	iso-C ₄ H ₉	Cl	142 až 145
65	CN	terc.C ₄ H ₉	H	130 až 135
66	CN	terc.C ₄ H ₉	Cl	120 až 124
67	CN	iso-C ₅ H ₁₁	H	144 až 146
68	CN	iso-C ₅ H ₁₁	Cl	104 až 107
69	CN	cyklopropyl	Cl	170 až 183
70	CN	cyklohexyl	H	185 až 190
71	CN	cyklohexyl	Cl	130 až 133
72	CN	3-chlorpropyl	Cl	117 až 120
73	CN	CH ₂ OCH ₃	Cl	

Tabulka 1 - pokračování

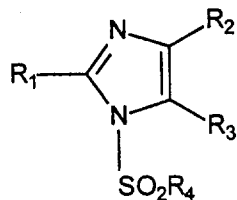
meziprodukt č.	R ₁	R ₂	R ₃	teplota tání (°C)
74	CN	CH ₂ OC ₂ H ₅	Cl	
75	CN	benzyl	Cl	144 až 146
76	CN	fenethyl	Cl	147 až 152
77	CN	SC ₂ H ₅	H	112 až 115
78	CN	SC ₂ H ₅	Cl	128 až 131
79	CN	S-n-C ₄ H ₉	H	97 až 99
80	CN	S-n-C ₄ H ₉	Cl	95 až 99
81	CN	3-fluorpropyl	Cl	
82	CN	SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	175 až 180
83	CN	3-chlorfenyl	H	140 až 143
84	CN	3-chlorfenyl	Cl	124 až 128
85	CN	2,3-dichlorfenyl	H	202 až 206
86	CN	2,3-dichlorfenyl	Cl	198 až 204
87	CN	3-chlor-4-methoxyfenyl	Cl	158 až 160
88	CN	3-chlor-4-methoxyfenyl	Br	161 až 163
89	CN	3-chlor-4-methylfenyl	Cl	165 až 169
90	CN	4-kyanfenyl	H	240 až 244
91	CN	4-kyanfenyl	Cl	250 až 255
92	CN	4-kyanfenyl	Br	239 až 244
93	CN	4-ethoxyfenyl	Cl	151 až 153
94	CN	4-ethoxyfenyl	Br	140 až 145
95	CN	2-fluorfenyl	H	190 až 195
96	CN	2-fluorfenyl	Cl	155 až 159
97	CN	2-methoxyfenyl	H	155 až 159
98	CN	2-methoxyfenyl	Cl	223 až 230
99	CN	3,4-methylendioxyfenyl	H	228 až 231
100	CN	3,4-methylendioxyfenyl	Cl	149 až 152
101	CN	3,4-methylendioxyfenyl	Br	166 až 169

V případě, že zbytky ve významu symbolů R₂ a R₃ jsou rozdílné, zahrnují meziprodukty obecného vzorce II tautomerní látky odpovídající následujícím obecným vzorcům II-a a II-b

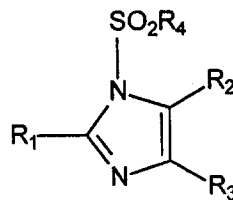


v nichž symboly R₁, R₂ a R₃ mají shora uvedený význam.

V souladu s tím v případě, že se imidazolové deriváty obecného vzorce I podle vynálezu připravují za použití sloučenin obecného vzorce II jako výchozích látek, lze získat produkty odpovídající níže uvedeným vzorcům I-a a I-b



(I-a)



(I-b)

v nichž R_1 , R_2 , R_3 a R_4 mají shora uvedený význam.

V případě, že R_2 a R_3 představují odlišné zbytky, jsou imidazolové deriváty obecných vzorců I-a a I-b tautomerní. Totéž platí o sloučeninách obecných vzorců I-1, I-5, I-6 a I-7 popsaných výše u postupů B až D apod.

Imidazolové deriváty shora uvedených obecných vzorců I-a a I-b lze oddělit, a to například níže popsanými metodami E-1 až E-3.

E-1 Metoda za použití chromatografie

Individuální látky je možno ze směsi isomerů obecných vzorců I-a a I-b izolovat pomocí chromatografie na sloupci silikagelu, preparativní kapalinové chromatografie s vysokou rozlišovací schopností, velmi rychlé chromatografie apod. V případě chromatografie na sloupci silikagelu je možno jako eluční činidlo používat například *n*-hexan, tetrachlormethan, methylenchlorid, chloroform, ethylacetát nebo směsi těchto rozpouštědel.

E-2 Metoda za použití překrystalování

Individuální komponenty je možno ze směsi isomerů obecných vzorců I-a a I-b izolovat překrystalováním za použití vhodného rozpouštědla, jako například tetrachlormethanu, methylenchloridu, chloroformu, 1,2-dichlorethanu, ethylacetátu, diethyletheru, tetrahydrofuranu, acetonu nebo směsi těchto rozpouštědel.

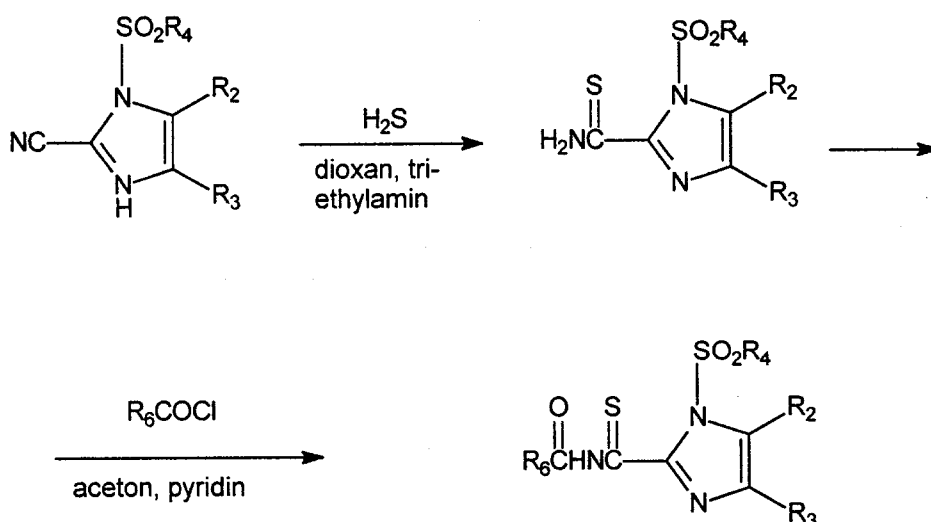
E-3 Metoda za použití rozkladu

Individuální komponenty je možno izolovat ze směsi isomerů obecných vzorců I-a a I-b pomocí selektivní hydrolyzy prováděné při teplotě od 0 do 80 °C (s výhodou od teploty místnosti do 50 °C) po dobu od 1 do 48 hodin (s výhodou od 5 do 24 hodin).

Jako směs isomerů k dělení podle shora popsaných metod E-1 až E-3 se s výhodou nasazuje směs obsahující co největší množství jednoho z obou isomerů. Takovouto směs je možno získat vhodnou volbou reakčních podmínek ve shora popsaném postupu A, například vhodnou volbou druhu rozpouštědla a akceptoru kyseliny, množství těchto činidel, reakční teploty, reakční doby apod.

Imidazolové deriváty, v nichž R_1 znamená skupinu $-\text{CSNH}_2$ nebo $-\text{CSNHR}_5$, kde R_5 má shora uvedený význam, je možno připravit ze sloučenin obecného vzorce I-b, kde R_1 představuje kyanoskupinu, separovaných za použití shora popsané metody E-1, E-2 nebo E-3, například následujícím postupem:

Schéma F



Ve vzorcích uvedených v tomto reakčním schématu mají R_2 , R_3 , R_4 a R_6 shora uvedený význam. Syntézu imidazolových derivátů podle vynálezu ilustrují následující příklady provedení, jimiž se však rozsah vynálezu nijak neomezuje.

Příklad 1

Syntéza 3-kyan-1-dimethylsulfamoylimidazolu (sloučenina č. 1)

Při teplotě místnosti se smísí 30 g 2-kyanimidazolu, 53,4 g bezvodého uhličitanu draselného a 600 ml acetonitrilu. Výsledná směs se nechá 2 hodiny reagovat za varu pod zpětným chladičem, pak se ochladí a přidá se k ní 55,6 g dimethylsulfamoylchloridu, načež se směs další 2 hodiny zahřívá k varu pod zpětným chladičem.

Po ukončení reakce se reakční směs vylije do vody a extrahuje se methylenchloridem. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje. Zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla. Získá se 28,0 g 2-kyan-1-dimethylsulfamoylimidazolu (sloučenina č. 1) o teplotě tání 74 až 76 °C.

Příklad 2

Syntéza 2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-fenylthioimidazolu (sloučenina č. 10-b)

Do čtyřhrdlé baňky se v proudu dusíku předloží 12,0 g 2-kyan-1-dimethylsulfamoylimidazolu (sloučenina č. 1) a 240 ml suchého tetrahydrofuranu. K směsi se za chlazení v lázni tvořené pevným oxidem uhličitým v acetonu na -75 °C nebo na teplotu nižší přikape 41,3 ml 1,6M roztoku *n*-butyllithia v hexanu (výrobek firmy Aldrich). Po skončeném přikapávání se směs nechá ještě 15 minut reagovat při shora uvedené teplotě a pak se k ní při teplotě pod -70 °C přikape roztok 17 g difenyldisulfidu ve 30 ml tetrahydrofuranu. Výsledná směs se pak za míchání nechá přes noc ohřát na teplotu místnosti.

Po ukončení reakce se reakční směs vylije do vody a extrahuje se 500 ml ethylacetátu. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a ethylacetát se oddestiluje. Zbytek se

vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla. Získá se 4,3 g 2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-fenylthioimidazolu (sloučenina č. 10-b) o teplotě tání 106 až 107 °C.

Příklad 3

Syntéza 4-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-n-propylimidazolu (sloučenina č. 16-b)

(1) Analogickým postupem jako v příkladu 2 se reakcí 12,0 g 2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-imidazolu (sloučenina č. 1) a 15,3 g n-propyljodidu připraví 4,8 g 2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-n-propylimidazolu (sloučenina č. 3-b) o teplotě tání 51 až 52 °C.

(2) Smísí se 4,8 g 2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-n-propylimidazolu připraveného výše v odstavci (1), 40 ml pyridinu a 11,4 g pyridiniumchloridu a směs se 4 hodiny míchá při teplotě 90 °C. Po ukončení reakce se pyridin oddestiluje a odparek se extrahuje ethylacetátem. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a ethylacetát se oddestiluje. Zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití směsi ethylacetátu a n-hexanu jako elučního činidla. Po separaci se získá 2,46 g 2-kyan-4(5)-n-propylimidazolu (meziprodukt č. 55) o teplotě tání 52 až 54 °C.

(3) Smísí se 2,35 g 2-kyan-4(5)-n-propylimidazolu připraveného výše v odstavci (2), 80 ml chloroformu a 2,6 g N-chlorsukcinimidu a směs se nechá 4 hodiny reagovat za varu pod zpětným chladičem. Po ukončení reakce se k reakční směsi přidá 200 ml vody, organická vrstva se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a chloroform se oddestiluje. Zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití směsi stejných dílů ethylacetátu a n-hexanu jako elučního činidla. Po separaci se získá 2,2 g 4(5)-chlor-2-kyan-5(4)-n-propylimidazolu (meziprodukt č. 14) o teplotě tání 107 až 109 °C.

(4) Smísí se 2,0 g 4(5)-chlor-2-kyan-5(4)-n-propylimidazolu připraveného výše v odstavci (3), 30 ml acetonitrilu, 1,95 g bezvodého uhličitánu draselného a 1,86 g dimethylsulfamoylchloridu. Směs se postupně zahřeje k varu a nechá se 1 hodinu reagovat za varu pod zpětným chladičem. Po ukončení reakce se z reakční směsi oddestiluje aceton, k zbytku se přidá 100 ml vody a směs se extrahuje 50 ml methylenchloridu. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a methylenchlorid se oddestiluje. Zbytek se nechá stát přes noc a pak se podrobí analýze, podle níž se jeden ze dvou isomerů přítomných ve směsi rozložil a přešel zpět na výchozí 4(5)-chlor-2-kyan-5(4)-n-propylimidazol. Zbytek obsahující druhý isomer se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla. Po separaci se získá 1,1 g 4-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-n-propylimidazolu (sloučenina 16-b) o teplotě tání 64 až 66 °C.

Příklad 4

Syntéza 2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-4(5)-fenylimidazolu (sloučenina č. 4)

(1) Ve 320 ml acetonu se rozpustí 23,04 g 4(5)-fenylimidazolu a k roztoku se přidá 12,14 g bezvodého uhličitánu draselného. Směs se 2 hodiny zahřívá k varu pod zpětným chladičem, pak se ochladí a přikape se k ní 45 ml acetonového roztoku obsahujícího 25,25 g dimethylsulfamoylchloridu. Po ukončení přidávání se směs k dokončení reakce 4,5 hodiny zahřívá k varu pod zpětným chladičem.

Po ukončení reakce se reakční směs ochladí, pevný materiál se odfiltruje, z filtrátu se za sníženého tlaku oddestiluje rozpouštědlo a zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu

za použití methylenchloridu jako elučního činidla. Získá se 17,8 g 1-dimethylsulfamoyl-4(5)-fenylimidazolu o teplotě tání 96 až 100 °C.

(2) Ve 290 ml tetrahydrofuranu se rozpustí 17 g 1-dimethylsulfamoyl-4(5)-fenylimidazolu připraveného výše v odstavci (1), roztok se v proudu dusíku ochladí na -70 °C a během 30 minut se k němu přikape 51 ml 1,6M roztoku n-butyllithia v hexanu. Po ukončení přidávání se reakční směs 30 minut míchá při teplotě -70 °C a pak se k ní přikape 12 ml tetrahydrofuranového roztoku obsahujícího 6 g N,N-dimethylformamidu. Po skončení přidávání se reakční směs 15 hodin míchá, přičemž se její teplota nechá pozvolna vystoupit na teplotu místnosti.

Po ukončení reakce se reakční směs vylije do vody s ledem a extrahuje se ethylacetátem. Po promytí extraktu vodou se organická vrstva vysuší bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku. Zbytek poskytne po vyčištění chromatografií na sloupci silikagelu za použití směsi ethylacetátu a n-hexanu (1:2) jako elučního činidla 12,8 g 1-dimethylsulfamoyl-2-formyl-4(5)-fenylimidazolu o teplotě tání 86 až 89 °C.

(3) Ve 120 ml pyridinu se rozpustí 11,16 g 1-dimethylsulfamoyl-2-formyl-4(5)-fenylimidazolu připraveného výše v odstavci (2) a 5,56 g hydroxylamin-hydrochloridu, a k roztoku se při teplotě místnosti přikape 24 ml acetanhydridu. Po ukončení přidávání se teplota směsi postupně zvýší a směs se nechá 12 hodin reagovat při teplotě 100 °C.

Po ukončení reakce se rozpouštědlo oddestiluje za sníženého tlaku, k zbytku se přidá 125 ml vody a vysrážený pevný materiál se odfiltruje. Surový produkt se rozpustí v ethylacetátu a vyčistí se chromatografií na sloupci silikagelu za použití ethylacetátu jako elučního činidla. Získá se 5,55 g 2-kyan-4(5)-fenylimidazolu o teplotě tání 203 až 205 °C.

(4) V 88 ml acetonu se rozpustí 1,7 g 2-kyan-4(5)-fenylimidazolu připraveného výše v odstavci (3) a k roztoku se přidá 1,7 g bezvodého uhličitanu draselného. Směs se pak 2 hodiny zahřívá k varu pod zpětným chladičem.

Po ochlazení se k směsi přikape 6 ml acetonového roztoku obsahující 1,7 g dimethylsulfamoylchloridu a po skončení přikapávání se výsledná směs k dokončení reakce 2 hodiny zahřívá k varu pod zpětným chladičem.

Reakční směs se ochladí a pevný materiál se odfiltruje. Z filtrátu se za sníženého tlaku oddestiluje rozpouštědlo a zbytek se extrahuje ethylacetátem. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku. Získají se 2 g 2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-4(5)-fenylimidazolu o teplotě tání 101 až 102 °C.

Příklad 5

Syntéza 4(5)-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5(4)-fenylimidazolu (sloučenina č. 17) a 4-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-fenylimidazolu (sloučenina č. 17-b)

(1) Ve 100 ml chloroformu se rozpustí 1,352 g 2-kyan-4(5)-fenylimidazolu, k roztoku se přidá 1,175 g N-chlorsukcinimidu a směs se 4 hodiny zahřívá k varu pod zpětným chladičem.

Po ukončení reakce se reakční směs vylije do vody a extrahuje se chloroformem. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a rozpouštědlem se oddestiluje za sníženého tlaku. Zbytek poskytne po vyčištění chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla 1,28 g 4(5)-chlor-2-kyan-5(4)-fenylimidazolu (mezi-produkt č. 15) o teplotě tání 149 až 151 °C.

(2) V 6 ml acetonu se rozpustí 0,43 g 4(5)-chlor-2-kyan-5(4)-fenylimidazolu připraveného výše v odstavci (1) a k roztoku se přidá 0,29 g bezvodého uhličitanu draselného a 0,36 g dimethylsulfamoylchloridu. Výsledná směs se pak nechá 30 minut reagovat za varu pod zpětným chladičem.

Po ukončení reakce se reakční směs vylije do vody a extrahuje se ethylacetátem. Extrakt se po promytí vodou vysuší bezvodým síranem sodným, rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku a zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla. Získá se 0,5 g 4(5)-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5(4)-fenylimidazolu (sloučenina č. 17) o teplotě tání 106 až 109 °C.

Podle NMR spektroskopie je shora uvedený produkt tvořen směsí isomerů sestávající z téměř stejných dílů 4-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-fenylimidazolu a 5-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-4-fenylimidazolu.

(3) 2,9 g směsi těchto isomerů, připravená analogickým postupem jako v odstavci (2), se nechá 24 hodiny stát při teplotě místnosti a pak se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla. Získá se 1,15 g 4-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-fenylimidazolu (sloučenina č. 17-b) o teplotě tání 109 až 112 °C. Dále pak se z tohoto produktu izolací a čištěním získá 0,7 g 4(5)-chlor-2-kyan-5(4)-fenylimidazolu (meziprodukt č. 15).

Příklad 6

Syntéza 4(5)-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5(4)-(4-methylfenyl)imidazolu (sloučenina č. 18) a 4-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-(4-methylfenyl)imidazolu (sloučenina č. 18-b) Analogickým postupem jako v příkladech 4 a 5 se získá směs isomerů (sloučenina č. 18) o teplotě tání 101 až 108 °C, sestávající z 4-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-(4-methylfenyl)imidazolu a 5-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-4-(4-methylfenyl)imidazolu v poměru 6:4. 0,75 g této směsi isomerů se nechá 8 hodin reagovat při teplotě 40 °C a pak se reakční směs vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla. Získá se 0,45 g 4-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-(4-methylfenyl)imidazolu (sloučenina č. 18-b) o teplotě tání 133 až 134 °C. Z výše uvedené sloučeniny se čištěním a izolací získá rovněž 0,15 g 4(5)-chlor-2-kyan-5(4)-(4-methylfenyl)imidazolu (meziprodukt č. 12) o teplotě tání 124 až 129 °C.

Příklad 7

Syntéza 4(5)-chlor-5(4)-(4-chlorfenyl)-2-kyan-1-dimethylsulfamoylimidazolu (sloučenina č. 23), 4-chlor-5(4-chlorfenyl)-2-kyan-1-dimethylsulfamoylimidazolu (sloučenina č. 23-b) a 5-chlor-4-(4-chlorfenyl)-2-kyan-1-dimethylsulfamoylimidazolu (sloučenina č. 23-a)

Analogickým postupem jako v příkladech 4 a 5 se z 4(5)-(4-chlorfenyl)imidazolu získá 0,80 g směsi isomerů (sloučenina č. 23) o teplotě tání 108 °C, tvořené 4-chlor-5-(4-chlorfenyl)-2-kyan-1-dimethylsulfamoylimidazolem a 5-chlor-4-(4-chlorfenyl)-2-kyan-1-dimethylsulfamoylimidazolem. Tato směs se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla. Druhá frakce eluátu se zahustí a zbytek se překrystaluje z methylenchloridu, čímž se získá 0,16 g 4-chlor-5-(4-chlorfenyl)-2-kyan-1-dimethylsulfamoylimidazolu (sloučenina č. 23-b) o teplotě tání 117 až 120 °C. Vymytá první frakce se rovněž zahustí a odparek se překrystaluje z methylenchloridu. Získá se 0,50 g 5-chlor-4-(4-chlorfenyl)-2-kyan-1-dimethylsulfamoylimidazolu (sloučenina č. 23-a) o teplotě tání 133 až 138 °C.

Příklad 8

Syntéza 1-dimethylsulfamoyl-4(5)-fenylimidazol-2-karbothioamidu (sloučenina č. 49)

Ve 30 ml dioxanu se rozpustí 1,0 g 2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-4(5)-fenylimidazolu (sloučenina č. 4) a k roztoku se přidá 0,36 g triethylaminu. Směs se za míchání zahřeje na 40 až 50 °C, po dobu 1 hodiny a 25 minut se do ní uvádí plynný sirovodík, načež se výsledná směs nechá ještě 50 minut reagovat při teplotě 40 až 50 °C.

Po ukončení reakce se reakční směs ochladí, vylíje se do vody a extrahuje se ethylacetátem. Extrakt se po promytí vodou vysuší bezvodým síranem sodným, rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku a zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití směsi ethylacetátu a n-hexanu (1:3) jako elučního činidla. Získá se 0,8 g 1-dimethylsulfamoyl-4(5)-fenylimidazol-2-karbothioamidu (sloučenina č. 49) o teplotě tání 155 až 175 °C. Získá se rovněž malé množství krystalického 4(5)-fenylimidazol-2-karbothioamidu.

Příklad 9

Syntéza 2-kyan-1-isopropylsulfonyl-4(5)-fenylimidazolu (sloučenina č. 101)

Při teplotě místnosti se smísí 1 g 2-kyan-4(5)-fenylimidazolu, 0,98 g bezvodého uhličitanu draselného a 30 ml acetonitrilu a směs se nechá 2 hodiny reagovat za varu pod zpětným chladičem. Reakční směs se ochladí a přidá se k ní roztok 1,0 g isopropylsulfonylchloridu v 5 ml acetonitrilu. Výsledná směs se pak nechá znovu reagovat 1,5 hodiny za varu pod zpětným chladičem.

Po ukončení reakce se směs vylíje do vody a extrahuje se methylenchloridem. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku. Zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla. Získá se 1,4 g 2-kyan-1-isopropylsulfonyl-4(5)-fenylimidazolu (sloučenina č. 101) o teplotě tání 80 až 83 °C.

Příklad 10

Syntéza 4(5)-(2-thienyl)-2-kyan-1-dimethylsulfamoylimidazolu (sloučenina č. 6)

(1) Do 150 ml formamidu se vnese 25 g 2-(bromacetyl)thiofenu a směs se nechá 2 hodiny reagovat při teplotě 180 až 190 °C.

Po ukončení reakce se reakční směs vylíje do vody, směs se okyselí koncentrovanou kyselinou chlorovodíkovou a promyje se methylenchloridem. Po neutralizaci vodným amoniakem se vodná fáze extrahuje methylenchloridem, extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku. Získá se 11 g 4(5)-(2-thienyl)-imidazolu.

(2) Do 200 ml acetonitrilu se vnese 11,6 g dimethylsulfamoylchloridu, 11,1 g bezvodého uhličitanu draselného a 11 g 4(5)-(2-thienyl)imidazolu připraveného výše v odstavci (1). Výsledná směs se pak nechá 2 hodiny reagovat za míchání.

Po ukončení reakce se reakční směs vylíje do vody a extrahuje se ethylacetátem. Extrakt se po promytí vodou vysuší bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku, čímž se získá 14,5 g 4(5)-(2-thienyl)-1-dimethylsulfamoylimidazolu.

(3) 9,5 g 4(5)-(2-thienyl)-1-dimethylsulfamoylimidazolu připraveného výše v odstavci (2) se rozpustí ve 120 ml bezvodého tetrahydrofuranu a k tomuto roztoku se při teplotě -78 °C v proudu dusíku přikape 26,2 ml 1,6M roztoku n-butyllithia v hexanu. Směs se při shora uvedené teplotě 15 minut míchá a pak se k ní přikape 20 ml tetrahydrofuranového roztoku obsahujícího 5,4 g N,N-dimethylformamidu. Po skončeném přikapávání se k dokončení reakce nechá směs postupně ohřát na teplotu místnosti.

Reakční směs se vylije do vody a extrahuje se ethylacetátem. Extrakt se promyje vodou a po vysušení bezvodým síranem sodným se rozpouštědlo oddestiluje za sníženého tlaku. Získá se 5,4 g 4(5)-(2-thienyl)-2-formyl-1-dimethylsulfamoylimidazolu.

(4) V 54 ml pyridinu se rozpustí 2,6 g hydroxylamin-hydrochloridu a 5,4 g 4(5)-2-thienyl)-2-formyl-1-dimethylsulfamoylimidazolu připraveného výše v odstavci (3). Roztok se 15 minut míchá při teplotě místnosti a pak se k němu postupně přidá 10 ml acetanhydridu. Směs se nechá 2 hodiny reagovat při teplotě 60 až 70 °C.

Po ukončení reakce se reakční směs vylije do vody a extrahuje se ethylacetátem. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku. Zbytek poskytne po vyčištění chromatografií na sloupci silikagelu, za použití směsi ethylacetátu a n-hexanu (2:1) jako elučního činidla 1,2 g 4(5)-(2-thienyl)-2-kyanimidazolu (meziprodukt č. 47) o teplotě tání 195 až 203 °C.

(5) Do 50 ml acetonitrilu se vnese 1,1 g dimethylsulfamoylchloridu, 1,0 g bezvodého uhličitanu draselného a 1,2 g 4(5)-(2-thienyl)-2-kyanimidazolu připraveného výše v odstavci (4). Směs se pak nechá 2 hodiny reagovat za zahřívání k varu pod zpětným chladičem.

Po ukončení reakce se reakční směs vylije do vody a extrahuje se ethylacetátem. Extrakt se vysuší bezvodým síranem sodným, rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku a zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla. Získá se 1,3 g 4(5)-(2-thienyl)-2-kyan-1-dimethylsulfamoylimidazolu (sloučenina č. 6) o teplotě tání 145 až 150 °C.

Příklad 11

Syntéza 4(5)-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5(4)-isopropylimidazolu (sloučenina č. 125) a 4-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-isopropylimidazolu (sloučenina č. 125-b)

(1) 360 g formamidu se zahřeje na 180 °C a během 30 minut se k němu přikape 102 g 1-hydroxy-3-methyl-2-butanonu připraveného postupem, který popsali Lipshutz a Morey, J. Org. Chem., **48**, 3745 (1983). Po skončeném přikapávání se směs nechá 1 hodinu reagovat při teplotě 180 °C.

Po ukončení reakce se reakční směs ochladí a vylije se do vody s ledem. Výsledná směs se kyselinou chlorovodíkovou okyselí na pH 1 a promyje se methylenchloridem. Hodnota pH vodné vrstvy se vodným roztokem amoniaku upraví na 4 až 5, přidá se 5 g aktivního uhlí a směs se 1 hodinu míchá. Aktivní uhlí se odfiltruje a filtrát se vodným roztokem amoniaku zalkalizuje na pH 8. Směs se extrahuje methylenchloridem, extrakt se vysuší bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku, čímž se získá 13 g 4(5)-isopropylimidazolu.

(2) Ve 300 ml acetonitrilu se rozpustí 11,8 g 4(5)-isopropylimidazolu připraveného výše v odstavci (1) a k roztoku se přidá 18 g bezvodého uhličitanu draselného. Směs se 30 minut zahřívá k varu pod zpětným chladičem, pak se ochladí a přikape se k ní 17 g dimethyl-

sulfamoylchloridu. Po skončeném přikapávání se výsledná směs zahřívá k varu pod zpětným chladičem.

Po ukončení reakce se reakční směs ochladí, vylije se do vody a extrahuje se ethylacetátem. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku. Zbytek poskytne po vyčištění chromatografií na sloupci silikagelu, za použití methylenchloridu jako elučního činidla, 13 g 1-dimethylsulfamoyl-4(5)-isopropylimidazolu.

(3) Ve 200 ml tetrahydrofuranu se rozpustí 13 g 1-dimethylsulfamoyl-4(5)-isopropylimidazolu. připraveného výše v odstavci (2), roztok se v proudu dusíku ochladí na $-70\text{ }^{\circ}\text{C}$ a během 15 minut se k němu přikape 38 ml 1,6M roztoku n-butyllithia v hexanu. Po skončeném přikapávání se směs 30 minut míchá při teplotě $-70\text{ }^{\circ}\text{C}$, načež se k ní přikape 5,6 g N,N-dimethylformamidu a výsledná směs se nechá za míchání 15 hodin reagovat, přičemž se její teplota nechá pomalu vystoupit na teplotu místnosti.

Po ukončení reakce se reakční směs vylije do vody s ledem a extrahuje se ethylacetátem. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku. Získá se 8,6 g 1-dimethylsulfamoyl-2-formyl-4(5)-isopropylimidazolu.

(4) Ve 100 ml pyridinu se rozpustí 8,5 g 1-dimethylsulfamoyl-2-formyl-4(5)-isopropylimidazolu připraveného výše v odstavci (3) a 4,8 g hydroxylamin-hydrochloridu, a k roztoku se při teplotě místnosti přikape 10 ml acetanhydridu. Po skončeném přikapávání se teplota postupně zvyší a směs se nechá 5 hodin reagovat při teplotě 80 až $90\text{ }^{\circ}\text{C}$.

Po ukončení reakce se rozpouštědlo z reakční směsi oddestiluje za sníženého tlaku, k odparku se přidá voda a směs se extrahuje ethylacetátem. Extrakt se promyje zředěnou kyselinou chlorovodíkovou a pak vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku. Získá se 2,35 g 2-kyan-4(5)-isopropylimidazolu (meziprodukt č. 61) o teplotě tání 88 až $91\text{ }^{\circ}\text{C}$.

(5) V 80 ml methanolu se rozpustí 2 g 2-kyan-4(5)-isopropylimidazolu připraveného výše v odstavci (4) a k roztoku se přidá 2,1 g N-chlorsukcinimidu. Směs se míchá nejprve 20 hodin při teplotě místnosti a pak se nechá 8 hodin reagovat při teplotě $40\text{ }^{\circ}\text{C}$.

Po ukončení reakce se z reakční směsi oddestiluje ve vakuu methanol, k zbytku se přidá voda a směs se extrahuje ethylacetátem. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku. Odparek poskytne po vyčištění chromatografií na sloupci silikagelu, za použití methylenchloridu jako elučního činidla, 1,67 g 4(5)-chlor-2-kyan-5(4)-isopropylimidazolu (meziprodukt č. 62) o teplotě tání 84 až $87\text{ }^{\circ}\text{C}$.

(6) Ve 30 ml acetonitrilu se rozpustí 1,6 g 4(5)-chlor-2-kyan-5(4)-isopropylimidazolu připraveného výše v odstavci (5) a k roztoku se přidá 1,56 g bezvodého uhličitanu draselného. Směs se 30 minut míchá za varu pod zpětným chladičem, pak se ochladí a přikape se k ní 1,49 g dimethylsulfamoylchloridu. Po skončeném přikapávání se směs k dokončení reakce 15 minut zahřívá k varu pod zpětným chladičem.

Reakční směs se ochladí, vylije se do vody a extrahuje se ethylacetátem. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku. Zbytek poskytne po vyčištění chromatografií na sloupci silikagelu, za použití methylenchloridu jako elučního činidla, 2,1 g 4(5)-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5(4)-isopropylimidazolu (sloučenina č. 125).

Podle NMR spektroskopie je shora uvedený produkt tvořen směsí isomerů sestávající z 4-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-isopropylimidazolu a 5-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-4-isopropylimidazolu v poměru cca 2:1.

(7) 2,1 g směsi isomerů získané výše v odstavci (6) se nechá 5 dnů stát při teplotě místnosti a pak se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla. Získá se 1 g 4-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-isopropylimidazolu (sloučenina č. 125-b) tajícího za rozkladu při 75 až 82 °C. Z výše uvedené sloučeniny se čištěním a izolací získá rovněž 4(5)-chlor-2-kyan-5(4)-isopropylimidazol (meziprodukt č. 62).

Příklad 12

Syntéza 4-chlor-1-dimethylsulfamoyl-5-n-propylimidazol-2-karbothioamidu (sloučenina č. 185-b)

(1) Do čtyřhrdlé baňky se v proudu dusíku předloží 6,0 g 2-kyan-4,5-dichlor-1-dimethylsulfamoylimidazolu o teplotě tání 100 až 103 °C a 180 ml suchého tetrahydrofuranu. Za udržování teploty chlazením pevným oxidem uhličitým v acetonu na -75 °C nebo na teplotě nižší se k směsi postupně přikape 15,3 ml 1,6M roztoku n-butyllithia v hexanu (výrobek firmy Aldrich), reakční směs se 15 minut chladí na shora uvedenou teplotu, pak se k ní při teplotě -70 °C nebo při teplotě nižší přikape roztok 5,7 g n-propyljodidu v 15 ml tetrahydrofuranu a výsledná směs se přes noc míchá, přičemž se její teplota nechá postupně vystoupit na teplotu místnosti.

Po ukončení reakce se reakční směs vylije do vody a extrahuje se 500 ml methylenchloridu. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a methylenchlorid se oddestiluje. Zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla a pak novou chromatografií na sloupci silikagelu za použití směsi ethylacetátu a n-hexanu jako elučního činidla. Získá se 2,8 g 4-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-n-propylimidazolu (sloučenina č. 16-b) o teplotě tání 66 až 68 °C.

(2) Do čtyřhrdlé baňky se předloží 2,7 g 4-chlor-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-n-propylimidazolu připraveného výše v odstavci (1), 40 ml dioxanu, 1,0 g triethylaminu a 0,8 g pyridinu. Do této směsi se pak při teplotě 20 až 25 °C po dobu zhruba 30 minut uvádí plynný sirovodík až do vymizení výchozího materiálu.

Po ukončení reakce se reakční směs vylije do vody, vysrážené krystaly se odfiltrují pomocí odsávací nálevky a vysuší se. Tento krystalický materiál poskytne po vyčištění chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla 2,3 g 4-chlor-1-dimethylsulfamoyl-5-n-propylimidazol-2-karbothioamidu (sloučenina č. 185-b) o teplotě tání 160 až 162 °C.

Příklad 13

Syntéza N-propionyl-4-chlor-1-dimethylsulfamoyl-5-n-propylimidazol-2-karbothioamidu (sloučenina č. 187-b)

Do čtyřhrdlé baňky se předloží 2,0 g 4-chlor-1-dimethylsulfamoyl-5-n-propylimidazol-2-karbothioamidu (sloučenina č. 185-b), 24 ml acetonu a 1,12 g pyridinu. K směsi se při teplotě 0 až 5 °C přikape 1,19 g propionylchloridu a po skončeném přikapávání se směs nechá reagovat nejprve 1 hodinu při teplotě 30 až 35 °C a pak za míchání dalších 30 minut za varu pod zpětným chladičem.

Po ukončení reakce se reakční směs vylije do vody a extrahuje se ethylacetátem. Extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a ethylacetát se oddestiluje. Zbytek poskytne po vyčištění chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla 1,02 g N-propionyl-4-chlor-1-dimethylsulfamoyl-5-n-propylimidazol-2-karbothioamidu (sloučenina č. 187-b) o teplotě tání 150 až 152 °C.

Příklad 14

Syntéza 2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-4,5-difenylothioimidazolu (sloučenina č. 141)

(1) Smísí se 8,0 g 2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-fenylthioimidazolu (sloučenina č. 10-b) připraveného obdobným postupem, jaký je popsán výše v příkladu 2, 60 ml methanolu a 60 ml 7% vodného roztoku kyseliny chlorovodíkové a směs se nechá za míchání 2 hodiny reagovat při teplotě 40 až 50 °C. Po ukončení reakce se reakční směs slabě zalkalizuje amoniakem, vysrážené krystaly se odfiltrují a vysuší se. Získá se 4,2 g 2-kyan-4(5)-fenylthioimidazolu (meziprodukt č. 26) o teplotě tání 166 až 169 °C.

(2) K směsi 4,2 g 2-kyan-4(5)-fenylthioimidazolu, připraveného výše v odstavci (1), 80 ml acetonitrilu a 3,1 g bezvodého uhličitánu draselného se přidá 3,4 g dimethylsulfamoylchloridu a výsledná směs se nechá 1 hodinu reagovat za varu pod zpětným chladičem. Po ukončení reakce se reakční směs ochladí a pevný materiál se odfiltruje. Z filtrátu se oddestiluje rozpouštědlo a odparek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla. Izoluje se 5,8 g 2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-4(5)-fenylthioimidazolu (sloučenina č. 10).

(3) Do čtyřhrdlé baňky se v dusíkové atmosféře předloží 5,8 g 2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-4(5)-fenylthioimidazolu připraveného výše v odstavci (2) a 150 ml suchého tetrahydrofuranu, a k směsi se za udržování teploty chlazením pevným oxidem uhličitým v acetonu na -75 °C nebo na hodnotě nižší přikape 12,9 ml 1,6M roztoku n-butyllithia v hexanu (výrobce Kanto Kagaku). Po skončeném přikapávání se směs ještě 15 minut chladí na shora uvedenou teplotu, načež se k ní při teplotě -70 °C nebo při teplotě nižší přikape 20 ml roztoku 5,2 g difenyldisulfidu v tetrahydrofuranu. Výsledná směs se pak nechá ohřát na teplotu místnosti.

Po ukončení reakce se reakční směs extrahuje ethylacetátem, extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje. Zbytek se vyčistí chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla. Izoluje se 1,7 g 2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-4,5-difenylothioimidazolu (sloučenina č. 141) o teplotě tání 98 až 101 °C.

Příklad 15

Syntéza 4-brom-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-n-propylimidazolu (sloučenina č. 157-b)

(1) Analogickým postupem jako v příkladu 1 se z 2-kyan-4,5-dibromimidazolu o teplotě tání 200 až 203 °C připraví 2-kyan-4,5-dibrom-1-dimethylsulfamoylimidazol o teplotě tání 118 až 120 °C.

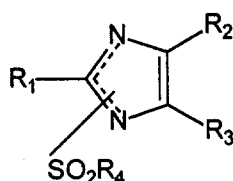
(2) Do čtyřhrdlé baňky o objemu 200 ml se v proudu dusíku předloží 5 g 2-kyan-4,5-dibrom-1-dimethylsulfamoylimidazolu připraveného výše v odstavci (1) a 120 ml suchého tetrahydrofuranu. Za udržování teploty chlazením pevným oxidem uhličitým v acetonu na -75 °C nebo na nižší hodnotě se k směsi postupně přikape 9,6 ml 1,6M roztoku n-butyllithia v hexanu (výrobek firmy Aldrich). Po skončeném přikapávání se reakční směs chladí na shora uvedenou

teplotu ještě 15 minut, načež se k ní za chlazení na teplotu $-75\text{ }^{\circ}\text{C}$ nebo na teplotu nižší přikape roztok 3,6 g n-propyljodidu v 15 ml tetrahydrofuranu. Výsledná směs se pak nechá za míchání postupně ohřát na teplotu místnosti.

Po ukončení reakce se reakční směs extrahuje ethylacetátem, extrakt se promyje vodou, vysuší se bezvodým síranem sodným a ethylacetát se oddestiluje. Zbytek poskytne po vyčištění chromatografií na sloupci silikagelu za použití methylenchloridu jako elučního činidla 2,1 g 4-brom-2-kyan-1-dimethylsulfamoyl-5-n-propylimidazolu (sloučenina č. 157-b) o teplotě tání 93 až 94 $^{\circ}\text{C}$.

Typické příklady imidazolových derivátů obecného vzorce I podle vynálezu jsou uvedeny v následující tabulce 2.

Tabulka 2



(I)

Sl. č.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	teplota tání (°C)
1	CN	H	H	-N(CH ₃) ₂	74 až 76
2	CN	CH ₃	H	-N(CH ₃) ₂	78 až 83
4	CN	fenyl	H	-N(CH ₃) ₂	101 až 102
5	CN	4-chlorfenyl	H	-N(CH ₃) ₂	148 až 149
6	CN	2-thienyl	H	-N(CH ₃) ₂	145 až 150
7	CN	5-chlor-2-thienyl	H	-N(CH ₃) ₂	145 až 148
8	CN	5-brom-2-thienyl	H	-N(CH ₃) ₂	138 až 140
11	CN	2-chlorfenyl	H	-N(CH ₃) ₂	118 až 121
12	CN	4-nitrofenyl	H	-N(CH ₃) ₂	107 až 108
17	CN	fenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	106 až 109
18	CN	4-methylfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	101 až 108
19	CN	3-methylfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	90 až 95
21	CN	3,4-dimethylfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	95 až 105
22	CN	4-methoxyfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	102 až 107
23	CN	4-chlorfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	108
25	CN	3,4-dichlorfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	99 až 105
26	CN	4-fluorfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	105 až 107
31	CN	terc.butyl	Br	-N(CH ₃) ₂	88 až 90
33	CN	4-methylfenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	106 až 108
34	CN	4-terc.butylfenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	105 až 110
35	CN	4-methoxyfenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	96 až 99
36	CN	4-fluorfenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	87 až 93
41	CN	4-bromfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	110 až 116
43	CN	2-naftyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	124 až 126
44	CN	CH ₃	CH ₃	-N(CH ₃) ₂	52 až 54
45	CN	fenyl	CH ₃	-N(CH ₃) ₂	101 až 105

Tabulka 2 - pokračování

Sl. č.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	teplota tání (°C)
47	CN	fenyl	fenyl	-N(CH ₃) ₂	148 až 149
48	CN	fenyl	CN	-N(CH ₃) ₂	124 až 129
49	-CSNH ₂	fenyl	H	-N(CH ₃) ₂	155 až 175
50	-CSNH ₂	4-chlorfenyl	H	-N(CH ₃) ₂	197 až 201
51	-CSNH ₂	fenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	110 až 130
52	-CSNH ₂	H	Br	-N(CH ₃) ₂	140 až 144
66	CN	3,4-dichlorfenyl	H	-N(CH ₃) ₂	139 až 142
74	CN	CH ₃	NO ₂	-N(CH ₃) ₂	110 až 117
84	CN	5-methyl-2-furyl	H	-N(CH ₃) ₂	120 až 124
87	CN	4-(chlormethylthio)fenyl	H	-N(CH ₃) ₂	142 až 146
88	CN	CH ₃	CN	-N(CH ₃) ₂	80 až 84
101	CN	fenyl	H	isopropyl	80 až 83
103	CN	fenyl	Cl	-N(C ₂ H ₅) ₂	70 až 80
104	CN	fenyl	Br	-N(C ₂ H ₅) ₂	55 až 76
105	CN	fenyl	Cl	morfolino	106 až 110
106	CN	fenyl	Br	morfolino	70 až 83
114	CN	2-furyl	2-furyl	-N(CH ₃) ₂	118 až 123
115	CN	4-pyridyl	H	-N(CH ₃) ₂	138 až 142
134	CN	S-n-C ₄ H ₉	Cl	-N(CH ₃) ₂	36 až 38
141	CN	fenylthio	fenylthio	-N(CH ₃) ₂	98 až 101
151	CN	benzyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	94 až 97
166	CN	OCH ₂ CF ₃	Br	-N(CH ₃) ₂	77 až 79
180	CN	H	I	-N(CH ₃) ₂	101 až 105
190	CN	-SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	-N(CH ₃) ₂	142 až 149
212	CN	4-nitrofenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	140 až 145
3-b	CN	n-C ₃ H ₇	H	-N(CH ₃) ₂	51 až 52
9-b	CN	SCH ₃	H	-N(CH ₃) ₂	114 až 115
10-b	CN	fenylthio	H	-N(CH ₃) ₂	106 až 107
14-b	CN	H	Cl	-N(CH ₃) ₂	111 až 114
15-b	CN	CH ₃	Cl	-N(CH ₃) ₂	90 až 95
16-b	CN	n-C ₃ H ₇	Cl	-N(CH ₃) ₂	64 až 66
17-b	CN	fenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	109 až 112
18-b	CN	4-methylfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	133 až 134
20-b	CN	2-methylfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	93 až 96
23-a	CN	4-chlorfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	133 až 138
23-b	CN	4-chlorfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	117 až 120
24-b	CN	2-chlorfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	113 až 117
26-b	CN	4-fluorfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	120 až 122
27-b	CN	SCH ₃	Cl	-N(CH ₃) ₂	101 až 103
28-b	CN	fenylthio	Cl	-N(CH ₃) ₂	107 až 108
29-b	CN	H	Br	-N(CH ₃) ₂	100 až 103
30-b	CN	CH ₃	Br	-N(CH ₃) ₂	107 až 110
32-b	CN	fenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	122 až 124
33-b	CN	4-methylfenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	136 až 137
39-b	CN	C ₂ H ₅	Br	-N(CH ₃) ₂	112 až 115
40-b	CN	-CH ₂ CH=CH ₂	Br	-N(CH ₃) ₂	92 až 94
42-a	CN	4-isopropylfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	110 až 114
46-a	CN	fenyl	SCH ₃	-N(CH ₃) ₂	99 až 101
51-b	-CSNH ₂	fenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	115 až 128
53-b	-CSNH ₂	fenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	110 až 118

Tabulka 2 - pokračování

Sl. č.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	teplota tání (°C)
55-b	CN	3-methyl-4-methoxyfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	115 až 118
56-b	CN	4-ethylfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	110 až 112
57-b	CN	fenylthio	Br	-N(CH ₃) ₂	94 až 97
58-b	CN	benzyl	Br	-N(CH ₃) ₂	87 až 89
60-b	CN	-SO ₂ C ₂ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	121 až 124
61-b	CN	3-fluorpropyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	75 až 79
65-b	CN	2-chlorfenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	119 až 123
67-b	CN	4-(2',2',2'-trifluorethoxy)fenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	111 až 113
68-b	CN	4-(2',2',2'-trifluorethoxy)fenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	115 až 118
69-b	CN	-CH ₂ OH	H	-N(CH ₃) ₂	106 až 107
70-b	CN	3-chlorfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	96 až 99
73-b	CN	-SCH ₂ CH=CH ₂	H	-N(CH ₃) ₂	20 až 30
75-b	CN	1,2-difenylethyl	H	-N(CH ₃) ₂	101 až 103
76-b	CN	α-hydroxybenzyl	H	-N(CH ₃) ₂	98 až 100
103-b	CN	fenyl	Cl	-N(C ₂ H ₅) ₂	99 až 101
106-b	CN	fenyl	Br	morfolino	126 až 130
111-b	CN	4-chlorfenylthio	Cl	-N(CH ₃) ₂	92 až 94
112-b	CN	3-chlorpropyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	102 až 105
113-b	CN	C ₂ H ₅	Cl	-N(CH ₃) ₂	95 až 97
119-b	CN	n-C ₄ H ₉	Cl	-N(CH ₃) ₂	48 až 49
120-b	CN	n-C ₅ H ₁₁	Cl	-N(CH ₃) ₂	37 až 39
121-b	CN	n-C ₆ H ₁₃	Cl	-N(CH ₃) ₂	n _D ^{23,5} 1,500 2
122-b	CN	n-C ₇ H ₁₅	Cl	-N(CH ₃) ₂	n _D ^{23,5} 1,501 9
123-b	CN	n-C ₈ H ₁₇	Cl	-N(CH ₃) ₂	n _D ^{23,5} 1,498 1
124-b	CN	n-C ₁₂ H ₂₅	Cl	-N(CH ₃) ₂	34 až 36
125-b	CN	iso-C ₃ H ₇	Cl	-N(CH ₃) ₂	75 až 82 (rozklad)
126-b	CN	iso-C ₄ H ₉	Cl	-N(CH ₃) ₂	73 až 76
127-b	CN	terc.C ₄ H ₉	Cl	-N(CH ₃) ₂	74 až 80
128-b	CN	cyklopropyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	76 až 79
129-b	CN	cyklohexyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	107 až 111
130-b	CN	-CH ₂ CH=CH ₂	Cl	-N(CH ₃) ₂	67 až 72
132-b	CN	SC ₂ H ₅	Cl	-N(CH ₃) ₂	107 až 110
133-b	CN	S-n-C ₃ H ₇	Cl	-N(CH ₃) ₂	70 až 74
135-b	CN	benzylthio	Cl	-N(CH ₃) ₂	149 až 152
136-b	CN	3-trifluormethyl-2-pyridylthio	Cl	-N(CH ₃) ₂	126 až 127
137-b	CN	3-trifluormethyl-2-pyridylthio	H	-N(CH ₃) ₂	109 až 111
138-b	CN	4-chlorfenylthio	H	-N(CH ₃) ₂	110 až 112
140-a	CN	SC ₂ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	36 až 40
140-b	CN	SC ₂ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	41 až 45
142-a	CN	fenylthio	C ₂ H ₅	-N(CH ₃) ₂	86 až 89
145-b	CN	4-chlorbutyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	n _D ^{22,1} 1,538 2

Tabulka 2 - pokračování

Sl. č.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	teplota tání (°C)
146-b	CN	5-chlorpentyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	n _D ^{24,8} 1,532 8
147-b	CN	CH ₂ OCH ₃	Cl	-N(CH ₃) ₂	64 až 66
148-b	CN	CH ₂ OC ₂ H ₅	Cl	-N(CH ₃) ₂	82 až 84
149-b	CN	1-hydroxypropyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	70 až 73
150-b	CN	1-hydroxybutyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	n _D ^{24,2} 1,509 7
151-b	CN	benzyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	92 až 100
152-b	CN	4-methylbenzyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	125 až 129
153-b	CN	3-methylbenzyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	93 až 96
154-b	CN	2-methylbenzyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	119 až 123
155-b	CN	2-fluorbenzyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	105 až 109
156-b	CN	fenethyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	106 až 110
157-b	CN	n-C ₃ H ₇	Br	-N(CH ₃) ₂	93 až 94
160-b	CN	n-C ₆ H ₁₃	Br	-N(CH ₃) ₂	99 až 101
165-b	CN	4-chlorfenylthio	Br	-N(CH ₃) ₂	94 až 95
167-b	CN	S-n-C ₃ H ₇	Br	-N(CH ₃) ₂	76 až 78
168-b	CN	S-n-C ₄ H ₉	Br	-N(CH ₃) ₂	48 až 50
169-b	CN	S-iso-C ₄ H ₉	Br	-N(CH ₃) ₂	77 až 79
170-b	CN	CH ₂ OCH ₃	Br	-N(CH ₃) ₂	65 až 67
171-b	CN	CH ₂ OC ₂ H ₅	Cl	-N(CH ₃) ₂	100 až 101
172-b	CN	methoxykarbonyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	98 až 101
173-b	CN	N-(4-chlorfenyl)-karbamoyl	Br	-N(CH ₃) ₂	106 až 109
174-b	CN	N-fenylkarbamoyl	Br	-N(CH ₃) ₂	105 až 107
175-b	CN	N-ethylkarbamoyl	Br	-N(CH ₃) ₂	98 až 100
181-a	CN	n-C ₃ H ₇	I	-N(CH ₃) ₂	76 až 79
181-b	CN	n-C ₃ H ₇	I	-N(CH ₃) ₂	99 až 103
182-a	CN	n-C ₃ H ₇	-COCF ₃	-N(CH ₃) ₂	90 až 92
185-b	-CSNH ₂	n-C ₃ H ₇	Cl	-N(CH ₃) ₂	160 až 162
186-b	N-acetylthio- karbamoyl	n-C ₃ H ₇	Cl	-N(CH ₃) ₂	119 až 123
187-b	N-propionyl- thiokarbamo- yl	n-C ₃ H ₇	Cl	-N(CH ₃) ₂	150 až 152
188-b	N- methylthio- karbamoyl	fenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	67 až 72
189-b	N-acetylthio- karbamoyl	fenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	110 až 114
191-b	CN	-Si(CH ₃) ₃	Cl	-N(CH ₃) ₂	116 až 119
192-b	CN	n-C ₁₀ H ₂₁	Cl	-N(CH ₃) ₂	n _D ^{23,6} 1,499 4
193-b	CN	C ₂ H ₅	H	-N(CH ₃) ₂	69 až 71
194-b	CN	n-C ₄ H ₉	H	-N(CH ₃) ₂	52 až 53
195-b	CN	S-n-C ₄ H ₉	H	-N(CH ₃) ₂	50 až 51
196-b	CN	1-hydroxy-3-fenylpropyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	n _D ^{24,0} 1,551 2
197-b	CN	1-hydroxypropyl	H	-N(CH ₃) ₂	94 až 97
198-b	CN	α-hydroxybenzyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	102 až 104

Tabulka 2 - pokračování

Sl. č.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	teplota tání (°C)
199-b	CN	α -acetoxybenzyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	82 až 86
200-b	CN	1-hydroxy-3-methylbutyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	71 až 74
201-b	CN	4-methyl-3-chlorfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	99 až 103
202-b	CN	4-methyl-3-chlorfenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	103 až 106
203-b	CN	4-methoxy-3-chlorfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	97 až 101
204-b	CN	4-methoxy-3-chlorfenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	105 až 110
205-b	CN	2,3-dichlorfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	103 až 107
206-b	CN	4-ethoxyfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	122 až 124
207-b	CN	4-ethoxyfenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	110 až 113
208-b	CN	3,4-methyendioxyfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	150 až 153
209-b	CN	3,4-methyendioxyfenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	95 až 98
210-b	CN	4-kyanfenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	182 až 185
211-b	CN	4-kyanfenyl	Br	-N(CH ₃) ₂	175 až 178
212-b	CN	4-nitrofenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	144 až 146
213-b	CN	2-butenyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	87 až 90
214-b	CN	iso-C ₅ H ₁₁	Cl	-N(CH ₃) ₂	45 až 47
218-b	-CSNH ₂	benzyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	118 až 121
222-b	N-acetylthio- karbamoyl	benzyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	163 až 165
223-n	N-propionyl- thiokarbamo- yl	benzyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	149 až 152
227-b	CN	3-chlorbutyl	Cl	-N(CH ₃) ₂	54 až 57
230-b	CN	-CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	Cl	-N(CH ₃) ₂	75 až 78

Jako fungicidy použitelné v zemědělství a zahradnictví vykazují sloučeniny podle vynálezu vynikající účinky proti chorobám napadajícím užitkové rostliny, jako jsou choroba rýže způsobovaná houbou *Pyricularia oryzae*, hniloba pochev rýže způsobovaná houbou *Rhizoctonia solani*, rzivost ovsu způsobovaná houbou *Colletotrichum lagenarium*, padlí na okurkách způsobované houbou *Sphaerotheca fuliginea*, peronospora okurek způsobovaná houbou *Pseudoperonospora cubensis*, hniloby rajčat způsobované houbami *Phytophthora infestans* a *Alternaria solani*, melanosa citrusů způsobovaná houbou *Diaporthe citri*, plísňové onemocnění citrusů způsobované houbou *Penicillium digitatum*, strupovitost hrušní způsobovaná houbou *Venturia nashicola*, skvrnitost listů jabloní způsobovaná houbou *Alternaria mali*, peronospora révy vinné způsobovaná houbou *Plasmopara viticola*, dále pak plísňová onemocnění způsobovaná houbou *Botrytis cinerea* a sklerotiniové choroby způsobované houbou *Sclerotinia sclerotiorum* na různých užitkových rostlinách, jakož i půdní choroby způsobované například fytopathogenními houbami náležejícím k rodům *Fusarium*, *Pythium*, *Rhizoctonia*, *Verticillium*, *Plasmodiophora*, *Aphanomyces* apod.

Popisované sloučeniny zejména vykazují vynikající preventivní účinek na takové choroby, jako jsou plíseň bramborová (*Phytophthora infestans*) na rajčatech a okurkách, peronospora okurek (*Pseudoperonospora cubensis*), peronospora révy vinné (*Plasmopara viticola*) a peronospora tabáková (*Peronospora tabacina*), jakož i na půdní choroby způsobované houbami náležejícími do třídy *Phycomycetes*, jako jsou rody *Plasmodiophora*, *Aphanomyces*, *Pythium* apod.

Sloučeniny podle vynálezu mají dlouhodobý residuální účinek, takže vykazují jednak vynikající preventivní účinnost a spolu s ní i výtečnou účinnost kurativní. Chorobu je tedy možno potírat i

po již proběhlé infekci. Sloučeniny podle vynálezu je možno aplikovat na listy ošetřovaných užitkových rostlin. Popisované sloučeniny dále vykazují systemickou účinnost, což umožňuje potírat choroby napadající stonky a listy rostlin aplikací účinných látek do půdy.

Sloučeniny podle vynálezu mimoto výtečně hubí hmyz škůdce vyskytující se v zemědělství a zahradnictví, jako jsou různí křísci a svítilky, předivka *Plutella xylostella*, *Nephotettix cincticeps*, *Callosobruchus chinensis*, *Spodoptera litura*, *Myzus persicae* (mšice broskvoňová), dále roztoči, jako je *Tetranychus urticae* (sviluška snovací) a *Tetranychus cinnabarinus*, *Panonychus citri* apod., a nematody, jako je háďátka *Meloidogyne incognita* apod.

K aplikačním účelům je možno sloučeniny podle vynálezu zpracovávat na různé prostředky, jako jsou emulgovatelné koncentráty, suspenzní koncentráty, popraše, smáčitelné prášky, vodné roztoky, granuláty apod., a to za použití nosných a pomocných látek, jak je to v daném oboru obvyklé. Tyto prostředky je možno používat buď jako takové nebo je lze ředit vhodným ředidlem, jako vodou apod., na žádanou nižší koncentraci.

Jako vhodné pomocné látky používané k shora zmíněnému účelu je možno uvést, kromě nosičů, například emulgátory, suspenzační činidla, dispergátory, penetrační činidla, smáčedla, zahušťovadla, stabilizátory apod.

Nosiče je možno rozdělit na nosiče pevné a nosiče kapalné. Jako příklady pevných nosičů lze uvést různé práškové materiály živočišného a rostlinného původu, jako jsou škroby, cukr, prášková celulóza, cyklodextrin, aktivní uhlí, sójová moučka, pšeničná mouka, mleté plevy, dřevní moučky, rybí moučky, sušené mléko apod., a minerální práškové materiály, jako jsou mastek, kaolin, bentonit, komplex bentonit-alkylamin, uhličitán vápenatý, síran vápenatý, hydrogenuhličitán sodný, zeolit, křemelina, koloidní oxid křemičitý, jíla, alumina, oxid křemičitý, prášková síra apod. Z kapalných nosičů lze jmenovat vodu, živočišné a rostlinné oleje, jako kukuřičný olej, sójový olej, bavlníkový olej apod., alkoholy, jako ethylalkohol, ethylenglykol apod., ketony, jako aceton, methylethylketon apod., ethery, jako dioxan, tetrahydrofuran apod., alifatické uhlovodíky, jako kerosen, petrolej, kapalný parafin apod., aromatické uhlovodíky, jako xylen, trimethylbenzen, tetramethylbenzen, cyklohexan, solventnaftu apod., halogenované uhlovodíky, jako chloroform, chlorbenzen apod., amidy kyselin, jako dimethylformamid apod., estery, jako ethylacetát, estery mastných kyselin s glycerolem apod., nitrily, jako acetonitril apod., sloučeniny obsahující síru, jako dimethylsulfoxid apod., dále N-methylpyrrolidon apod.

Jako příklady dalších pomocných látek (kromě nosičů), jako shora zmíněných emulgátorů, suspenzačních činidel, dispergátorů, penetračních činidel, smáčedel, zahušťovadel, stabilizátorů apod., lze uvést následující konkrétní povrchově aktivní činidla.

Polyoxyethylen-alkylarylethery, polyoxyethylenglykol-nonylfenylethery, polyoxyethylen-laurylether, polyoxyethylovaný ricinový olej, polyoxyethylen-alkylarylsulfáty (polyoxyethylen-alkylfenylether-sulfáty), polyoxyethylenestery mastných kyselin (polyoxyethylenstearát), estery polyoxyethylovaných mastných kyselin se sorbitanem, fosfatované nižší alkoholy, natrium-alkylsulfát, natrium-ligninsulfonát, ligninsulfonát vápenatý, alkylarylsulfonáty, natrium-alkylbenzensulfonáty, kondenzační produkt natrium- β -naftalensulfonátu s formaldehydem a dialkylsulfosukcináty.

K výrobě biocidního prostředku se sloučenina podle vynálezu homogenně smísí s alespoň jednou shora uvedenou nosnou nebo/a pomocnou látkou.

Hmotnostní poměr sloučeniny podle vynálezu k nosné či pomocné látce v biocidním prostředku se obecně pohybuje od 0,05:99,95 do 90:10, s výhodou od 0,2:99,8 do 80:20.

Protože koncentrace a aplikované dávky účinných látek podle vynálezu se mohou značně měnit v závislosti na ošetřované užitkové rostlině, na způsobu aplikace, aplikační formě apod., je velmi obtížné definovat nějaké přesné rozmezí koncentrací a dávek. Obecně lze však říci, že v případě aplikace na list se koncentrace účinné látky v aplikovaném prostředku obvykle pohybuje od 0,1 do 10 000 ppm, účelně od 1 do 2000 ppm, v případě půdní aplikace se pak dávky obvykle pohybují od 10 do 100 000 g/ha, účelně od 200 do 20 000 g/ha.

Je-li to žádoucí nebo účelné, lze sloučeniny podle vynálezu používat ve směsi nebo v kombinaci s jinými agrochemikáliemi, jako jsou například insekticidy, akaricidy, nematocidy, fungicidy, antivirová činidla, atraktanty, herbicidy, regulátory růstu rostlin apod. Při použití těchto směsí nebo kombinací lze někdy dosáhnout ještě lepších výsledků.

Jako příklady vhodných insekticidů, akaricidů a nematocidů je možno uvést organické sloučeniny fosforu, karbamáty, organické chlorderiváty, organokovové sloučeniny, pyrethroidy, deriváty benzoylmočoviny, sloučeniny typu juvenilního hormonu, dinitrosloučeniny, organické sloučeniny síry, deriváty močoviny, triazinové deriváty apod. Sloučeniny podle vynálezu lze rovněž používat ve směsi nebo v kombinaci s biologickými pesticidy, jako jsou BT-činidla, virové preparáty pathogenní pro hmyz apod.

Jako vhodné fungicidy je možno jmenovat například organické sloučeniny fosforu, organické chlorderiváty, dithiokarbamáty, N-halogenoalkylderiváty, dikarboximidoderiváty, benzimidazolové sloučeniny, azolové sloučeniny, karbinoly, benzanilidové deriváty, acylalaninové sloučeniny, morfolinové sloučeniny, anthrachinonové sloučeniny, chinoxalinové sloučeniny, deriváty krotonové kyseliny, deriváty sulfenových kyselin, deriváty močoviny, antibiotika apod.

V následující části jsou uvedeny testy účinnosti biocidních prostředků podle vynálezu proti škodlivým organismům v zemědělství a zahrádnictví.

Pokud není uvedeno jinak, vyhodnocují se výsledky jednotlivých testů podle následujících kritérií.

Účinnost se vyhodnocuje vizuálně tak, že se zjišťuje rozsah choroby na pokusné rostlině, a vyjadřuje se za pomoci následující stupnice:

stupeň účinnosti	rozsah choroby
5	rostlina není chorobou vůbec zasažena
4	plocha, počet nebo délka lézí je v porovnání s neošetřenou rostlinou nižší než 10 %
3	plocha, počet nebo délka lézí je v porovnání s neošetřenou rostlinou nižší než 40 %
2	plocha, počet nebo délka lézí je v porovnání s neošetřenou rostlinou nižší než 70 %
1	plocha, počet nebo délka lézí je v porovnání s neošetřenou rostlinou vyšší než 70 %

Test 1

Test preventivní účinnosti proti padlí na okurkách

V polyethylenovém květináči o průměru 7,5 cm se pěstuje rostlina okurky (odrůda Suyo). Když rostlina doroste do stadia 1 listu, postříká se za pomoci postřikové pistole 10 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu ve stanovené koncentraci. Ošetřená rostlina se jeden den a jednu noc uchovává v komoře s teplotou 22 až 24 °C a pak se inokuluje konidii houby *Sphaerotheca fuliginea* (padlí). Za 10 dnů se zjistí rozsah choroby na prvním listu, který se vyjádří za pomoci odpovídajícího stupně účinnosti definovaného výše.

Výsledky testu jsou uvedeny v následující tabulce 3.

Tabulka 3

sloučenina č.	stupeň účinnosti (500 ppm)
15-b	4
23-a	4
59-b	4
106-b	3
133-b	4
167-b	3
169-b	3
171-b	5

Test 2

Test preventivní účinnosti proti anthraknóze na okurkách

V polyethylenovém květináči o průměru 7,5 cm se pěstuje rostlina okurky (odrůda Suyo). Když rostlina doroste do stadia 2 listů, postříká se za pomoci postřikové pistole 10 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem stanovené koncentraci. Květináče s ošetřenými rostlinami se jeden den a jednu noc uchovávají v klimatizované komoře při teplotě 22 až 24 °C a pak se rostliny inokulují suspenzí spór houby *Colletotrichum lagenarium* vyvolávající anthraknózu. Za 7 dnů po inokulaci se zjistí rozsah choroby na prvním listu a za pomoci shora uvedené stupnice se vyjádří pomocí stupně účinnosti.

Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v následující tabulce 4.

Tabulka 4

sloučenina č.	stupeň účinnosti (500 ppm)
3-b	3
17-b	3
26	5
28-b	3
51	3
51-b	3
59-b	3
69-b	3
70-b	4
73-b	3
75-b	3
101	4
105	4
106	3

Test 3

Test preventivní účinnosti proti peronospóře na okurkách

V polyethylenovém květináči o průměru 7,5 cm se pěstuje rostlina okurky (odrůda Suyo). Když rostlina doroste do stadia 2 listů, postříká se za pomoci postřikové pistole 10 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem stanovené koncentraci. Květináče s ošetřenými rostlinami se jeden den a jednu noc uchovávají v klimatizované komoře při teplotě 22 až 24 °C a pak se inokulují suspenzí spór houby *Pseudoperonospora cubensis* vyvolávající peronosporu. Za 6 dnů po inokulaci se zjistí rozsah choroby na prvním listu a tento údaj se za pomoci shora uvedené stupnice převede na stupeň účinnosti.

Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v následující tabulce 5.

Tabulka 5

sloučenina č.	stupeň účinnosti	
	125 ppm	31 ppm
4	5	5
5	5	5
6	5	4
7	5	5
8	5	3
14-b	5	3
15-b	5	5
16-b	-	5
17	5	5
17-b	-	5
23	5	5
29-b	5	5
30-b	5	5
31	4	3
32-b	5	5
33	-	5
34	5	5
36	-	5
37	5	5
45	5	5
47	5	5
48	5	5
49	5	4
50	5	5
52	5	5
53-b	5	5
101	5	4
103	5	5
105	4	-
106	5	5

Test 4

Test kurativní účinnosti proti peronospoře na okurkách

V polyethylenovém květináči o průměru 7,5 cm se pěstuje rostlina okurky (odrůda Suyo), která po dosažení stadia 2 listů inokuluje suspenzí spór houby *Pseudoperonospora cubensis* vyvolávající peronosporu. Za 6 hodin po inokulaci se rostlina za použití postřikové pistole postříká 10 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem stanovené koncentraci. Květináče se jeden den a jednu noc uchovávají v klimatizované komoře při teplotě 22 až 24 °C, pak se zjistí rozsah choroby na prvním listu a tento údaj se za pomoci shora uvedené stupnice převede na stupeň účinnosti.

Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v následující tabulce 6.

Tabulka 6

sloučenina č.	stupeň účinnosti	
	125 ppm	31 ppm
3-b	5	-
8	5	-
9-b	5	-
10-b	5	-
12	5	-
14-b	5	-
15-b	5	-
16-b	5	-
17	5	-
17-b	5	-
18	-	5
18-b	5	-
19	5	-
20-b	5	-
22	5	-
23	5	-
23-a	5	-
23-b	5	-
24-b	-	5
25	-	4
26	-	5
26-b	5	-
27-b	5	-
28-b	5	-
29-b	5	-
30-b	5	-
32-b	5	-
33	5	-
33-b	5	-
36	5	-
37	5	-
39-b	-	5
40-b	-	5
41	-	5
46-a	5	-
48	4	-
51	5	-
51-b	5	-
52	5	-
53-b	5	-
56-b	5	-
57-b	-	5
58-b	-	5
59-b	-	5
60-b	-	5
61-b	-	5
65-b	5	-
67-b	5	-

Tabulka 6 - pokračování

sloučenina č.	stupeň účinnosti	
	125 ppm	31 ppm
68-b	-	4
69-b	4	-
70-b	5	-
72	-	5
74	-	4
76-b	5	-
88	-	5
101	4	-
103-b	5	-
106-b	5	-
111-b	-	5
112-b	5	5
113-b	5	5
119-b	5	5
120-b	5	5
121-b	5	5
125-b	-	5
126-b	-	5
128-b	-	5
129-b	-	5
130-b	5	5
132-b	-	5
133-b	5	4
134	5	5
135-b	4	-
136-b	-	3
138-b	-	5
141	4	-
142-a	5	5
145-b	-	5
146-b	-	5
147-b	5	5
148-b	5	5
149-b	-	5
150-b	5	-
151	-	5
151-b	5	5
152-b	-	3
153-b	-	5
154-b	-	5
155-b	-	5
156-b	-	5
157-b	-	5
160-b	5	5
166	5	3
167-b	5	5
169-b	5	5
170-b	5	5

Tabulka 6 - pokračování

sloučenina č.	stupeň účinnosti	
	125 ppm	31 ppm
171-b	5	5
173-b	4	-
180	5	-
181-a	-	5
181-b	-	5
185-b	-	5
186-b	-	5
187-b	-	5
189-b	5	5
190	5	4
201-b	4	-
203-b	3	-
208-b	4	3
209-b	5	-
210-b	4	-
212-b	5	5
213-b	-	5
214-b	-	5

Test 5

Test systemické účinnosti proti peronospoře na okurkách

V polyethylenovém květináči o průměru 7,5 cm se pěstuje rostlina okurky (odrůda Suyo), která se po dosažení stadia 2 listů ošetří tak, že se na povrch půdy v květináči pomocí pipety nanese 15 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem stanovené koncentraci. Květináče s ošetřenými rostlinami se dva dny uchovávají v klimatizované komoře při teplotě 22 až 24 °C a pak se inokulují suspenzí spór houby *Pseudoperonospora cubensis* vyvolávající peronosporu. Za 6 dnů po inokulaci se zjistí rozsah choroby na prvním listu a tento údaj se za pomoci shora uvedené stupnice převede na stupeň účinnosti.

Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v následující tabulce 7.

Tabulka 7

sloučenina č.	stupeň účinnosti	
	500 ppm	125 ppm
1	5	3
14-b	5	5
15-b	-	5
17	5	4
29-b	5	5
30-b	5	5
37	5	5
52	5	5
53-b	5	5

Test 6

Test preventivní účinnosti proti plísni na rajčatech

V polyethylenovém květináči o průměru 7,5 cm se pěstuje rostlina rajčete (odrůda Ponderosa). Když rostlina doroste do stadia 4 listů, postříká se za použití postřikové pistole 10 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem stanovené koncentraci. Květináče s ošetřenými rostlinami se jeden den a jednu noc uchovávají v klimatizované komoře při teplotě 22 až 24 °C a pak se inokulují suspenzí zoosporangií houby *Phytophthora infestans* (plíseň bramborová). Za 5 dnů po inokulaci se zjistí rozsah choroby na listech rostliny a tento údaj se za pomoci shora uvedené stupnice převede na stupeň účinnosti.

Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v následující tabulce 8.

Tabulka 8

sloučenina	stupeň účinnosti		
	125 ppm	31 ppm	8 ppm
3-b	-	5	-
4	5	4	-
5	5	5	-
6	5	4	-
7	5	5	-
8	5	5	-
9-b	-	5	-
10-b	-	-	5
12	-	5	3
14-b	-	5	-
15-b	-	4	-
16-b	-	5	4
17	5	5	-
17-b	5	5	-
18	-	5	-
18-b	-	5	-
19	-	5	-
20-b	-	5	-
21	-	5	-
22	-	5	-
23	5	5	-
23-a	-	5	-
23-b	-	5	-
24-b	-	5	5
25	-	5	5
26	-	5	-
26-b	-	5	-
27-b	-	5	-
28-b	-	5	-
29-b	5	5	-
30-b	-	5	-
32-b	5	5	-
33	5	5	-

Tabulka 8 - pokračování

sloučenina	stupeň účinnosti		
	125 ppm	31 ppm	8 ppm
33-b	-	5	-
34	4	4	-
36	5	5	-
37	-	5	-
39-b	-	-	5
50-b	-	5	5
41	-	5	5
42-a	-	5	-
42-b	-	5	-
43	-	-	5
45	5	5	-
46-a	5	5	-
48	5	5	-
49	5	3	-
50	4	-	-
51	5	5	-
51-b	5	5	-
52	5	4	-
53-b	5	5	-
55-b	-	4	5
56-b	-	5	-
57-b	-	-	5
58-b	-	5	5
59-b	-	-	5
60-b	-	5	-
61-b	-	5	5
65-b	-	5	-
66	5	5	-
67-b	-	-	5
68-b	-	-	5
70-b	-	-	5
72	-	-	5
73-b	-	4	-
74	-	-	5
75-b	-	5	-
76-b	-	5	-
84	-	-	5
88	-	-	5
101	5	5	-
103	5	-	-
104	5	4	-
105	5	4	-
106-b	5	4	-
111-b	-	-	4
112-b	-	5	5
113-b	-	-	5
114	-	5	5
119-b	-	5	5
120-b	-	5	5

Tabulka 8 - pokračování

sloučenina	stupeň účinnosti		
	125 ppm	31 ppm	8 ppm
121-b	-	5	5
122-b	-	5	5
123-b	-	5	5
124-b	-	5	5
125-b	-	-	5
126-b	-	-	5
128-b	-	5	4
129-b	-	5	5
130-b	-	5	5
132-b	-	5	5
133-b	-	-	5
134	-	5	5
135-b	-	5	5
136-b	-	-	5
137-b	-	-	5
138-b	-	-	4
141	-	5	5
142-a	-	5	5
145-b	-	-	4
146-b	-	5	5
147-b	-	4	3
148-b	-	4	-
149-b	-	-	5
151	-	-	5
151-b	-	5	5
152-b	-	-	5
153-b	-	-	5
154-b	-	-	5
155-b	-	-	5
156-b	-	-	5
157-b	-	-	5
160-b	-	5	5
166	-	5	3
167-b	-	5	5
169-b	-	5	5
170-b	-	5	3
171-b	-	5	-
173-b	-	4	3
174-b	-	4	-
180	-	-	5
181-a	-	5	5
182-b	-	5	5
185-b	-	-	5
186-b	-	-	5
187-b	-	-	5
189-b	-	5	4
190	-	4	-
201-b	-	5	5
202-b	-	5	5

Tabulka 8 - pokračování

sloučenina	stupeň účinnosti		
	125 ppm	31 ppm	8 ppm
203-b	-	4	5
205-b	-	-	5
206-b	-	5	5
207-b	-	5	-
208-b	-	5	5
209-b	-	4	-
210-b	-	4	3
211-b	-	4	-
212-b	-	5	3
213-b	-	5	5
214-b	-	5	5

Test 7

Test systemického účinku proti plísni na rajčatech

V polyethylenovém květináči o průměru 7,5 cm se pěstuje rostlina rajčete (odrůda Ponderosa). Když rajče doroste do stadia 4 listů, zalije se půda v květináči za pomoci pipety 15 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem stanovené koncentraci. Květináče se 2 dny udržují v klimatizované komoře při teplotě 22 až 24 °C, načež se pokusné rostliny inokulují suspenzí zoosporangií houby *Phytophthora infestans*. Za 5 dnů po inokulaci se zjistí rozsah choroby na listech rostliny a tento údaj se za pomoci shora uvedené stupnice převede na stupeň účinnosti.

Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v následující tabulce 9.

Tabulka 9

sloučenina č.	stupeň účinnosti	
	500 ppm	125 ppm
3-b	-	4
10-b	5	5
16-b	-	4
17-b	5	4
19	4	4
20-b	5	4
22	5	4
27-b	5	5
28-b	5	-
40-b	5	5
51	5	5
51-b	5	5
57-b	-	4
58-b	5	3
59-b	-	4
76-b	-	5

Test 8

Test preventivní účinnosti proti *Pyricularia oryzae*

V polyethylenovém květináči o průměru 7,5 cm se pěstuje rostlina rýže (odrůda Chukyo Asahi). Když rostlina doroste do stadia 4 listů, postříká se za pomoci postřikové pistole 20 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem stanovené koncentraci. Květináče s ošetřenými rostlinami se 1 den a 1 noc uchovávají v klimatizované komoře při teplotě 22 až 24 °C a pak se inokulují suspenzí spór houby *Pyricularia oryzae*. Za 5 dnů po inokulaci se zjistí počet lézí a tento údaj se za pomoci shora uvedené stupnice převede na stupeň účinnosti.

Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v následující tabulce 10.

Tabulka 10

sloučenina č.	stupeň účinnosti 500 ppm
27-b	4
48	3
53-b	3
55-b	4
134	3
167-b	3
201-b	4
202-b	4

Test 9

Test preventivní účinnosti proti hnilobě pochev rýže

V polyethylenovém květináči o průměru 7,5 cm se pěstuje rostlina rýže (odrůda Chukyo Asahi). Když rostlina doroste do stadia 5 listů, postříká se za pomoci postřikové pistole 20 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem stanovené koncentraci. Květináče s ošetřenými rostlinami se jeden den a jednu noc uchovávají v klimatizované komoře při teplotě 22 až 24 °C, a pak se inokulují tak, že se mezi pochvy jejich listů položí rýžová sláma, na níž byla inkubována houba vyvolávající hnilobu pochev (*Rhizoctonia solani*). Květináče s rostlinami se 5 dnů udržují ve vlhké komoře s teplotou 28 °C a 100% relativní vlhkostí vzduchu, načež se zjistí délka lézí a z tohoto údaje se za pomoci shora uvedené stupnice zjistí stupeň účinnosti.

Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v následující tabulce 11.

Tabulka 11

sloučenina č.	stupeň účinnosti 500 ppm
6	3
21	3
27-b	3
34	3
51-b	3
53-b	3
104	3

Test 10

Test preventivní účinnosti proti rzivosti ovsa

V polyethylenovém květináči o průměru 7,5 cm se pěstují rostliny ovsa (odrůda Zenshin). Když rostliny dorostou do stadia 2 listů, postříkají se za pomoci postřikové pistole 10 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem stanovené koncentraci. Květináče s ošetřenými rostlinami se jeden den a jednu noc uchovávají v klimatizované komoře při teplotě 22 až 24 °C a pak se inokulují konidii houby *Puccinia coronata*, vyvolávající rzivost ovsa. Za 10 dnů po inokulaci se zjistí plocha léze na druhém listu a tento údaj se za pomoci shora uvedené stupnice převede na stupeň účinnosti.

Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v následující tabulce 12.

Tabulka 12

sloučenina č.	stupeň účinnosti 500 ppm
4	3
14-b	3
44	4
52	4
59-b	4
104	4
172-b	4
180	5
190	3

Test 11

Test preventivní účinnosti proti nádorovitosti košťálovin

Květináč o ploše 1/140 m² se naplní půdou zamořenou houbou *Plasmodiophora brassicae* vyvolávající nádorovitost košťálovin a na povrch této půdy se za pomoci pipety nanese 20 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v koncentraci odpovídající aplikaci dávky jednak 4 g/m² a jednak 1 g/m². Za 1 den po ošetření se půda v květináči úplně promísí a zasijí se do ní

semena vodnice (odrůda Kanamachi Kokabu). Rostliny vodnice se pak dále pěstují ve skleníku. Za 30 dnů po zasetí se zjistí rozsah tvorby nádorů na kořenech rostliny a tento údaj se za pomoci níže uvedené stupnice převede na stupeň účinnosti:

stupeň účinnosti	výskyt nádorů
5	žádný
4	mírný
3	střední
2	četný
1	hojný

Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v následující tabulce 13.

Tabulka 13

sloučenina č.	stupeň účinnosti	
	4 g/m ²	1 g/m ²
1	5	-
4	4	-
5	5	5
6	5	5
7	5	5
8	5	5
9-b	5	4
10-b	-	5
12	-	5
14-b	5	5
15-b	-	5
16-b	5	5
17	-	5
17-b	-	5
18	5	5
18-b	-	5
19	5	5
20-b	5	4
21	5	5
22	5	5
23	5	5
23-a	-	4
23-b	-	4
24-b	-	5
26	5	4
26-b	-	5
27-b	5	5
29-b	-	5
30-b	-	5
32-b	-	5
33	5	5
33-b	-	5
34	5	5

Tabulka 13 - pokračování

sloučenina č.	stupeň účinnosti	
	4 g/m ²	1 g/m ²
36	5	5
37	5	5
39-b	-	5
40-b	-	5
42-a	-	5
42-b	-	5
46-a	5	-
49	-	4
50	5	5
51	5	5
51-b	5	5
52	-	5
53-b	5	4
55-b	-	5
56-b	-	5
58-b	-	5
59-b	5	5
65-b	-	5
67-b	-	5
68-b	-	5
73-b	4	-
88	-	4
105	4	-
106	5	-
180	5	5
201-b	-	5
202-b	-	5
206-b	-	5
207-b	-	5

Test 12

Test antimikrobiální účinnosti proti fytopathogenním houbám

Na agarové živné prostředí s bramborovým výluhem a dextrousou, obsahující 100 ppm streptomycinu a 100 ppm testované sloučeniny se přenese kruhový výřez mycelia vyříznutý z agaru, na němž byla pěstována houba *Pythium aphanidermatum*. Po inkubaci prováděné 48 hodin při teplotě 22 °C se změří průměr mycelia. Podle následujícího vzorce se pak zjistí inhibice vegetativního růstu v procentech.

$$\text{inhibice vegetativního růstu (\%)} = 100 - \frac{\text{průměr mycelia na ošetřeném agaru}}{\text{průměr mycelia na neošetřeném agaru}} \times 100$$

Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v následující tabulce 14.

Tabulka 14

sloučenina č.	inhibice vegetativního růstu (%)
3-b	100
5	95
7	100
9-b	100
10-b	100
14-b	100
15-b	100
16-b	100
17	100
17-b	100
23	100
27-b	100
28-b	100
29-b	100
30-b	100
31	100
33	100
34	100
36	100
37	100
45	100
49	100
53-b	100
101	100
103	100
104	100
105	100
106	100
180	100

Test 13

Test akaricidní účinnosti na dospělce svilušky snovací (*Tetranychus urticae*)

V polyethylenovém květináči o průměru 7,5 cm se pěstuje rostlina fazolu (odrůda Edogawa Saito). Když rostlina doroste do stadia primárních listů, ponechá se na ní jeden z těchto primárních listů a zbývající listy se odříznou. Rostlina se zamoří asi 30 dospělci svilušky snovací (*Tetranychus urticae*; rezistentní na Dicofol a organofosforečné insekticidy) a zhruba na 10 sekund se ponoří do 20 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem stanovené koncentraci. Po oschnutí se rostliny nechají stát v osvětlované klimatizované komoře při teplotě 26 °C. Za 2 dny po zamoření se zjistí počet mrtvých svilušek a podle následujícího vzorce se vypočítá mortalita v procentech:

$$\text{mortalita (\%)} = \frac{\text{počet mrtvých svilušek}}{\text{počet svilušek použitých k zamoření}} \times 100$$

Výsledky tohoto testu jsou uvedeny v následující tabulce 15.

Tabulka 15

sloučenina č.	mortalita (%)	
	800 ppm	200 ppm
9-b	100	100
10-b	100	100
14-b	100	100
15-b	100	100
23	100	100
23-a	91	-
23-b	100	-
26-b	100	-
29-b	100	100
36	100	100
40-b	100	100
41	100	-
52	100	100
57-b	100	-
58-b	100	-
72	100	-
88	100	-
101	100	100
112-b	100	-
113-b	100	100
119-b	100	100
133-b	100	90
151-b	100	-
167-b	100	87
169-b	100	100
172-b	100	-
205-b	100	-

Test 14

Test ovicidní účinnosti na vajíčka svilušky snovací (*Tetranychus urticae*)

Do polyethylenového květináče se přesadí rostlina fazolu mající pouze jeden primární list. Na rostlinu se přenesou dospělci svilušky snovací (*Tetranychus urticae*), kteří se na rostlině ponechají 24 hodiny k naklazení vajíček, načež se odstraní. Rostlina fazolu s nakladenými vajíčky se zhruba na 10 sekund ponoří do 20 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem určené koncentraci. Po oschnutí se rostliny fazolu uchovávají v osvětlované klimatizované komoře při teplotě 26 °C. Za 5 až 7 dnů po ošetření se zjistí, v jakém rozsahu byla ošetřená vajíčka schopna líhnouti a podle následujícího vzorce se vypočítá ovicidní účinnost v procentech:

$$\text{ovicidní účinnost (\%)} = \frac{\text{počet mrtvých vajíček}}{\text{počet nakladených vajíček}} \times 100$$

Úmrtí okamžitě po vylíhnutí se počítá do ovicidní účinnosti.

Výsledky dosažené při tomto testu jsou uvedeny v následující tabulce 16.

Tabulka 16

sloučenina č.	ovicidní účinnost (%) 800 ppm
10-b	100
15-b	100
26-b	100
29-b	100
30-b	70
40-b	100
52	98
57-b	90
88	100
101	100
113-b	100
119-b	100
133-b	100
167-b	100
169-b	100

Test 15

Insekticidní účinnost na *Laodelphax striatellus*

Mladé klíčící rostliny rýže se zhruba na 10 sekund ponoří do 20 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem stanovené koncentraci. Po oschnutí se kořeny rostliny obalí vlhkou vatou a vloží se do zkumavky. Do této zkumavky se vnese 10 larev (2. až 3. instar) *Laodelphax striatellus* a zkumavka se uzavře gázou, načež se za osvětlování uchovává v klimatizované komoře při teplotě 26 °C. Za 5 dnů po vložení larev se zjistí počet mrtvých exemplářů a podle následujícího vzorce se vypočítá mortalita v procentech:

$$\text{mortalita (\%)} = \frac{\text{počet mrtvých exemplářů hmyzu}}{\text{počet vložených exemplářů hmyzu}} \times 100$$

Výsledky dosažené při tomto testu jsou uvedeny v následující tabulce 17.

Tabulka 17

sloučenina č.	mortalita (%)	
	800 ppm	200 ppm
14-b	100	100
15-b	100	80
40-b	100	-
113-b	100	-
119-b	100	-
133-b	100	-
151-b	100	-

Test 16

Insekticidní účinnost na mšici broskvoňovou (*Myzus persicae*)

Kousek zelného listu se zhruba na 10 sekund ponoří do 20 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem stanovené koncentraci a pak se nechá oschnout. Do Petriho misky o průměru 9 cm se vloží vlhký filtrační papír, na který se položí ošetřený kousek zelného listu vysušený na vzduchu. Do misky se pak vypustí bezkřídle vivipární samičky mšice broskvoňové (*Myzus persicae*), miska se přikryje a za osvětlování se uchovává v klimatizované komoře při teplotě 26 °C. Za 2 dny po vpuštění hmyzu se zjistí počet mrtvých exemplářů a podle stejného vzorce jako v testu 15 se vypočítá mortalita v procentech.

Výsledky dosažené při tomto testu jsou uvedeny v následující tabulce 18.

Tabulka 18

sloučenina č.	mortalita (%)
	800 ppm
1	70
32-b	70
52	90

Test 17

Kousek zelného listu se zhruba na 10 sekund ponoří do 20 ml roztoku obsahujícího testovanou sloučeninu v předem stanovené koncentraci a pak se nechá oschnout. Do Petriho misky o průměru 9 cm se vloží vlhký filtrační papír, na který se položí ošetřený kousek zelného listu oschnutý na vzduchu. Do misky se pak vypustí larvy *Spodoptera litura* (2. a 3. instar), miska se přikryje a za osvětlování se uchovává v klimatizované komoře při teplotě 26 °C. Za 5 dnů po vpuštění larev se zjistí počet mrtvých exemplářů a stejným způsobem jako v testu 15 se vypočítá mortalita v procentech.

Výsledky dosažené v tomto testu jsou uvedeny v následující tabulce 19.

Tabulka 19

sloučenina č.	mortalita (%) 800 ppm
26-b	100
40-b	100
67-b	100
68-b	100
72	100
74	100

V následující části jsou uvedeny předpisy pro složení a přípravu prostředků podle vynálezu, jimiž se však rozsah vynálezu nikterak neomezuje.

Předpis 1

Smáčitelný prášek

(a) sloučenina č. 5	50 dílů hmotnostních
(b) kaolín	40 dílů hmotnostních
(c) ligninsulfonát sodný	7 dílů hmotnostních
(d) dialkylsulfosukcinát	3 díly hmotnostní

Předpis 2

Smáčitelný prášek

(a) sloučenina č. 17-b	20 dílů hmotnostních
(b) kaolín	72 dílů hmotnostních
(c) ligninsulfonát sodný	4 díly hmotnostní
(d) polyoxyethylen-alkylarylether	4 díly hmotnostní

Shora uvedené komponenty se smísí do homogenity.

Předpis 3

Smáčitelný prášek

(a) sloučenina č. 18-b	6 dílů hmotnostních
(b) křemelina	88 dílů hmotnostních
(c) dialkylsulfosukcinát	2 díly hmotnostní
(d) polyoxyethylen-alkylarylsulfát	4 díly hmotnostní

Shora uvedené komponenty se smísí do homogenity.

Předpis 4

Smáčitelný prášek

(a) kaolin	78 dílů hmotnostních
(b) kondenzační produkt natrium- β -naftalensulfonátu s formaldehydem	2 díly hmotnostní
(c) polyoxyethylen-alkylarylsulfát	5 dílů hmotnostních
(d) jemně mletý oxid křemičitý	15 dílů hmotnostních

Směs shora uvedených komponent a sloučeniny č. 22 se smísí v hmotnostním poměru 4:1.

Předpis 5

Smáčitelný prášek

(a) sloučenina č. 16-b	10 dílů hmotnostních
(b) křemelina	69 dílů hmotnostních
(c) práškový uhličitán vápenatý	15 dílů hmotnostních
(d) dialkylsulfosukcinát	1 díl hmotnostní
(e) polyoxyethylen-alkylarylsulfát	3 díly hmotnostní
(f) kondenzační produkt natrium- β -naftalensulfonátu s formaldehydem	2 díly hmotnostní

Shora uvedené složky se smísí do homogenity.

Předpis 6

Smáčitelný prášek

(a) sloučenina č. 14-b	0,05 dílu hmotnostního
(b) křemelina	93,95 dílu hmotnostního
(c) dialkylsulfosukcinát	2 díly hmotnostní
(d) polyoxyethylen-alkylarylsulfát	4 díly hmotnostní

Shora uvedené komponenty se smísí do homogenity.

Předpis 7

Smáčitelný prášek

(a) sloučenina č. 186-b	90 dílů hmotnostních
(b) křemelina	4 díly hmotnostní
(c) dialkylsulfosukcinát	1 díl hmotnostní
(d) polyoxyethylen-alkylarylsulfát	2 díly hmotnostní
(e) jemně mletý oxid křemičitý	3 díly hmotnostní

Shora uvedené komponenty se smísí do homogenity.

Předpis 8

Smáčitelný prášek

(a) sloučenina č. 16-b	10 dílů hmotnostních
(b) křemelina	69 dílů hmotnostních
(c) práškový uhličitan vápenatý	15 dílů hmotnostních
(d) dialkylsulfosukcinát	1 díl hmotnostní
(e) polyoxyethylen-alkylarylsulfát	3 díly hmotnostní
(f) kondenzační produkt natrium- β -naftalensulfonátu s formaldehydem	2 díly hmotnostní

Shora uvedené komponenty se smísí do homogenity.

Předpis 9

Smáčitelný prášek

(a) sloučenina č. 17-b	20 dílů hmotnostních
(b) kaolin	62,4 dílu hmotnostního
(c) jemně mletý oxid křemičitý	12,8 dílu hmotnostního
(d) alkylarylsulfonát	1,6 dílu hmotnostního
(e) polyoxyethylen-alkylarylsulfát	2,4 dílu hmotnostního
(f) polyoxyethylen-alkylarylether	0,8 dílu hmotnostního

Shora uvedené komponenty se smísí do homogenity.

Předpis 10

Popraš

(a) sloučenina č. 23	5 dílů hmotnostních
(b) mastek	94,5 dílu hmotnostního
(c) fosfát nižšího alkoholu	0,5 dílu hmotnostního

Shora uvedené komponenty se smísí do homogenity.

Předpis 11

Popraš

(a) sloučenina č. 16-b	0,2 dílu hmotnostního
(b) práškový uhličitan vápenatý	98,8 dílu hmotnostního
(c) fosfát nižšího alkoholu	1,0 dílu hmotnostního

Shora uvedené komponenty se smísí do homogenity.

Přepis 12

Popraš

(a) sloučenina č. 124-b	0,05 dílu hmotnostního
(b) práškový uhličitan vápenatý	98,95 dílu hmotnostního
(c) fosfát nižšího alkoholu	1,0 dílu hmotnostního

Shora uvedené komponenty se smísí do homogenity.

Předpis 13

Popraš

(a) sloučenina č. 189-b	20 dílů hmotnostních
(b) prášková uhličitan vápenatý	79 dílů hmotnostních
(c) fosfát nižšího alkoholu	1 díly hmotnostní

Shora uvedené komponenty se smísí do homogenity.

Předpis 14

Popraš

(a) sloučenina č. 185-b	90 dílů hmotnostních
(b) jemně mletý oxid křemičitý	9 dílů hmotnostních
(c) fosfát nižšího alkoholu	1 díl hmotnostní

Shora uvedené komponenty se smísí do homogenity.

Předpis 15

Emulgovatelný koncentrát

(a) sloučenina č. 26	20 dílů hmotnostních
(b) xylen	60 dílů hmotnostních
(c) polyoxyethylen-alkylarylether	20 dílů hmotnostních

Shora uvedené komponenty se smísí a směs se míchá až do vzniku roztoku.

Předpis 16

Emulgovatelný koncentrát

(a) sloučenina č. 132-b	0,05 dílu hmotnostního
(b) xylen	79,95 dílu hmotnostního
(c) polyoxyethylen-alkylarylether	20 dílů hmotnostních

Shora uvedené komponenty se smísí a směs se míchá do vzniku roztoku.

Předpis 17

Emulgovatelný koncentrát

(a) sloučenina č. 145-b	10 dílů hmotnostních
(b) xylén	70 dílů hmotnostních
(c) polyoxyethylen-alkylarylether	20 dílů hmotnostních

Shora uvedené komponenty se smísí a směs se míchá do vzniku roztoku.

Předpis 18

Emulgovatelný koncentrát

(a) sloučenina č. 123-b	50 dílů hmotnostních
(b) xylén	30 dílů hmotnostních
(c) polyoxyethylen-alkylarylether	20 dílů hmotnostních

Shora uvedené komponenty se smísí a směs se míchá do vzniku roztoku.

Předpis 19

Suspenzní koncentrát

(a) sloučenina č. 151	10 dílů hmotnostních
(b) kukuřičný olej	77 dílů hmotnostních
(c) oxethylovaný ricinový olej	12 dílů hmotnostních
(d) bentonit-alkylamin	1 díl hmotnostní

Shora uvedené komponenty se rovnoměrně promísí.

Předpis 20

Suspenzní koncentrát

(a) sloučenina č. 113-b	0,05 dílu hmotnostního
(b) kukuřičný olej	84,95 dílu hmotnostního
(c) oxethylovaný ricinový olej	12 dílů hmotnostních
(d) komplex bentonit-alkylamin	3 díly hmotnostní

Shora uvedené komponenty se rovnoměrně promísí.

Předpis 21

Suspenzní koncentrát

(a) sloučenina č. 119-b	30 dílů hmotnostních
(b) kukuřičný olej	58 dílů hmotnostních
(c) oxethylovaný ricinový olej	12 dílů hmotnostních

Shora uvedené komponenty se rovnoměrně promísí.

Předpis 22

Granule

(a) sloučenina č. 33-b	1 díl hmotnostní
(b) bentonit	61 dílů hmotnostních
(c) kaolin	33 dílů hmotnostních
(d) natrium–ligninsulfonát	5 dílů hmotnostních

K shora uvedeným komponentám se přidá potřebné množství vody, směs se promísí a granuluje.

Předpis 23

Granule

(a) sloučenina č. 112-b	0,05 dílu hmotnostního
(b) bentonit	60 dílů hmotnostních
(c) kaolin	34,95 dílu hmotnostního
(d) natrium–ligninsulfonát	5 dílů hmotnostních

K shora uvedeným komponentám se přidá potřebné množství vody, směs se promísí a granuluje.

Předpis 24

Granule

(a) sloučenina č. 17-b	10 dílů hmotnostních
(b) bentonit	60 dílů hmotnostních
(c) kaolin	25 dílů hmotnostních
(d) natrium–ligninsulfonát	5 dílů hmotnostních

K shora uvedeným komponentám se přidá potřebné množství vody, směs se promísí a granuluje.

Předpis 25

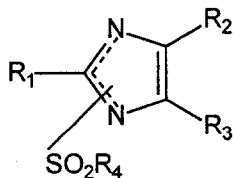
Granule

(a) sloučenina č. 178-b	50 dílů hmotnostních
(b) bentonit	45 dílů hmotnostních
(c) natrium–ligninsulfonát	5 dílů hmotnostních

K shora uvedeným komponentám se přidá potřebné množství vody, směs se promísí a granuluje.

PATENTOVÉ NÁROKY

I. Insekticidní, akaricidní a fungicidní prostředek pro potírání škodlivých organismů, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje 0,05 až 90 dílů hmotnostních imidazolového derivátu obecného vzorce I



(I)

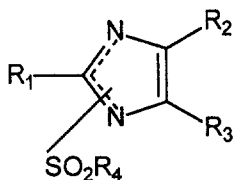
ve kterém

- R_1 představuje kyanoskupinu nebo zbytek vzorce $-CSNHR_5$, kde R_5 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo zbytek vzorce $-COR_6$, ve kterém R_6 představuje alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;
- R_2 představuje atom vodíku; cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku; naftylskupinu; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku; alkylskupinu se 7 až 12 atomy uhlíku; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituovaná jedním atomem halogenu, jednou hydroxyskupinou nebo jednou alkoxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituovaná jednou nebo dvěma fenylyskupinami; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituovaná jednou hydroxyskupinou a jednou fenylyskupinou; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituována jednou monohalogenovanou fenylyskupinou nebo jednou alkylovanou fenylyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části; halogenovanou alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; alkoxykarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části; alkenylskupinu se 2 až 6 atomy uhlíku; fenylyskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo dvěma atomy halogenu, alkylskupinami s 1 až 4 atomy uhlíku a/nebo alkoxyskupinami s 1 až 4 atomy uhlíku; fenylyskupinu, která je substituována jednou halogenovanou alkoxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, jednou nitroskupinou nebo jednou kyanoskupinou; fenylyskupinu, která je substituována jednou 3,4-methylenedioxyskupinou; furylskupinu, která je popřípadě substituována jednou alkylskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku; thienylskupinu, která je popřípadě substituována jedním atomem halogenu; skupinu obecného vzorce $-SR_7$, kde R_7 představuje alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenylskupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, benzylskupinu nebo fenylyskupinu, která je popřípadě substituována jedním atomem halogenu; skupinu $-SR_7$, kde R_7 představuje pyridylskupinu, která je popřípadě substituována trifluormethylskupinou; nebo skupinu obecného vzorce $-SO_2R_8$, kde R_8 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; skupinu $-SO_2N(R_9)_2$, kde R_9 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; nebo skupinu $-CONHR_{10}$, kde R_{10} představuje fenylyskupinu, která je popřípadě substituována jedním atomem halogenu;
- R_3 představuje atom vodíku; atom halogenu; kyanoskupinu; nitroskupinu; alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; fenylythioskupinu; fenylyskupinu; furylskupinu; nebo halogenovanou alkylkarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku a

R_4 představuje alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku nebo skupinu obecného vzorce $-NR_{11}R_{12}$, kde každý ze symbolů R_{11} a R_{12} představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo R_{11} a R_{12} společně, dohromady s přilehlým atomem dusíku, představují morfolinoskupinu;

a 10 až 99,95 dílu hmotnostního alespoň jednoho zemědělsky přijatelného nosiče nebo pomocné látky.

2. Insekticidní, akaricidní a fungicidní prostředek pro potírání škodlivých organismů podle nároku 1, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že jako účinnou složku obsahuje 0,05 až 90 dílů hmotnostních imidazolového derivátu obecného vzorce I



(I)

ve kterém

R_1 představuje kyanoskupinu nebo zbytek vzorce $-CSNHR_5$, kde R_5 znamená atom vodíku;

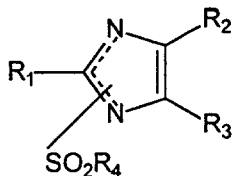
R_2 představuje atom vodíku; naftylskupinu; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku substituovanou jedním atomem halogenu, jednou monohalogenovanou fenylskupinou nebo jednou fenylskupinou alkylovanou alkylskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku substituovanou jednou nebo dvěma fenylskupinami; alkenylskupinu se 2 až 6 atomy uhlíku; fenylskupinu, která je popřípadě substituovaná jedním nebo dvěma atomy halogenu, alkylskupinami s 1 až 4 atomy uhlíku a/nebo alkoxy skupinami s 1 až 4 atomy uhlíku; fenylskupinu, která je substituována jednou halogenovanou alkoxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, jednou nitroskupinou nebo jednou kyanoskupinou; thienylskupinu, která je popřípadě substituována jedním atomem halogenu nebo skupinou vzorce $-SR_7$, kde R_7 představuje alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, benzylskupinu nebo fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním atomem halogenu;

R_3 představuje atom vodíku; atom halogenu; kyanoskupinu; alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; fenylthioskupinu nebo fenylskupinu;

R_4 představuje skupinu vzorce $-NR_{11}R_{12}$, kde R_{11} a R_{12} oba představují methylskupiny a

10 až 99,95 dílu hmotnostního alespoň jednoho zemědělsky přijatelného nosiče nebo pomocné látky.

3. Insekticidní, akaricidní a fungicidní prostředek pro potírání škodlivých organismů podle nároku 1, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že jako účinnou složku obsahuje 0,05 až 90 dílů hmotnostních imidazolového derivátu obecného vzorce I



(I)

ve kterém

R₁ představuje kyanoskupinu nebo zbytek vzorce $-\text{CSNHR}_5$, kde R₅ znamená atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo zbytek vzorce $-\text{COR}_6$, ve kterém R₆ představuje alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R₂ představuje atom vodíku; cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku; naftylskupinu; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituovaná jedním atomem halogenu, jednou hydroxyskupinou nebo jednou alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituovaná jednou nebo dvěma fenylyskupinami; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituovaná jednou nebo dvěma fenylyskupinami; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituovaná jednou hydroxyskupinou a jednou fenylyskupinou; alkenylskupinu se 2 až 6 atomy uhlíku; fenylyskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo dvěma atomy halogenu, alkylskupinami s 1 až 4 atomy uhlíku a/nebo alkoxykupinami s 1 až 4 atomy uhlíku; fenylyskupinu, která je substituována jednou halogenovanou alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, jednou nitroskupinou nebo jednou kyanoskupinou; furylskupinu, která je popřípadě substituována jednou alkylskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku; thienylskupinu, která je popřípadě substituována jedním atomem halogenu; skupinu obecného vzorce $-\text{SR}_7$, kde R₇ představuje alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenylskupinu, se 2 až 6 atomy uhlíku, benzylskupinu nebo fenylyskupinu, která je popřípadě substituována jedním atomem halogenu; nebo skupinu obecného vzorce $-\text{SO}_2\text{R}_8$, kde R₈ představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R₃ představuje atom vodíku; atom halogenu; kyanoskupinu; nitroskupinu; alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; fenylythioskupinu; fenylyskupinu; furylskupinu; nebo halogenovanou alkylkarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku a

R₄ představuje alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku nebo skupinu obecného vzorce $-\text{NR}_{11}\text{R}_{12}$, kde každý ze symbolů R₁₁ a R₁₂ představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo R₁₁ a R₁₂ společně, dohromady s přilehlým atomem dusíku, představují morfolinoskupinu,

příčemž když

(1) R₁ představuje kyanoskupinu nebo skupinu obecného vzorce $-\text{CSNHR}_5$, kde R₅ představuje atom vodíku,

(2) R₃ představuje atom vodíku; atom halogenu; kyanoskupinu; alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; fenylythioskupinu; nebo fenylyskupinu a

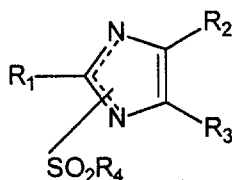
(3) R₄ představuje skupinu obecného vzorce $-\text{NR}_{11}\text{R}_{12}$, kde každý ze symbolů R₁₁ a R₁₂ představuje methylskupinu, potom

R₂ představuje cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituovaná jednou hydroxyskupinou nebo jednou alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituovaná jednou hydroxyskupinou

a jednou fenylskupinou; furylskupinu, která je popřípadě substituována jednou alkylskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku; skupinu obecného vzorce $-SR_7$, kde R_7 představuje alkenylskupinu, se 2 až 6 atomy uhlíku, nebo skupinu obecného vzorce $-SO_2R_8$, kde R_8 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

a 10 až 99,95 dílu hmotnostního alespoň jednoho zemědělsky přijatelného nosiče nebo pomocné látky.

4. Insekticidní, akaricidní a fungicidní prostředek pro potírání škodlivých organismů podle nároku 1, **vyznačující se tím**, že jako účinnou složku obsahuje 0,05 až 90 dílů hmotnostních imidazolového derivátu obecného vzorce I



(I)

ve kterém

R_1 představuje kyanoskupinu nebo zbytek vzorce $-CSNHR_5$, kde R_5 znamená atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo zbytek vzorce $-COR_6$, ve kterém R_6 představuje alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_2 představuje alkylskupinu se 7 až 12 atomy uhlíku; alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituována jednou monohalogenovanou fenylskupinou nebo jednou alkylovanou fenylskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části; fenylskupinu, která je substituována jednou 3,4-methyldioxoskupinou; halogenovanou alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části; skupinu obecného vzorce SR_7 , kde R_7 představuje pyridylskupinu, která je popřípadě substituována jednou trifluormethylskupinou; skupinu obecného vzorce $-SO_2N(R_9)_2$, kde R_9 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; nebo skupinu obecného vzorce $-CONHR_{10}$, kde R_{10} představuje fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním atomem halogenu;

R_3 představuje atom vodíku; atom halogenu; kyanoskupinu; nitroskupinu; alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; fenylthioskupinu; fenylskupinu; furylskupinu; nebo halogenovanou alkylkarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém zbytku a

R_4 představuje alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku nebo skupinu obecného vzorce $-NR_{11}R_{12}$, kde každý ze symbolů R_{11} a R_{12} představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo R_{11} a R_{12} společně, dohromady s přilehlým atomem dusíku, představují morfolinoskupinu,

přičemž když

(1) R_1 představuje kyanoskupinu nebo skupinu obecného vzorce $-CSNHR_5$, kde R_5 představuje atom vodíku,

(2) R_3 představuje atom vodíku; atom halogenu; kyanoskupinu; alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; fenylthioskupinu; nebo fenylskupinu a

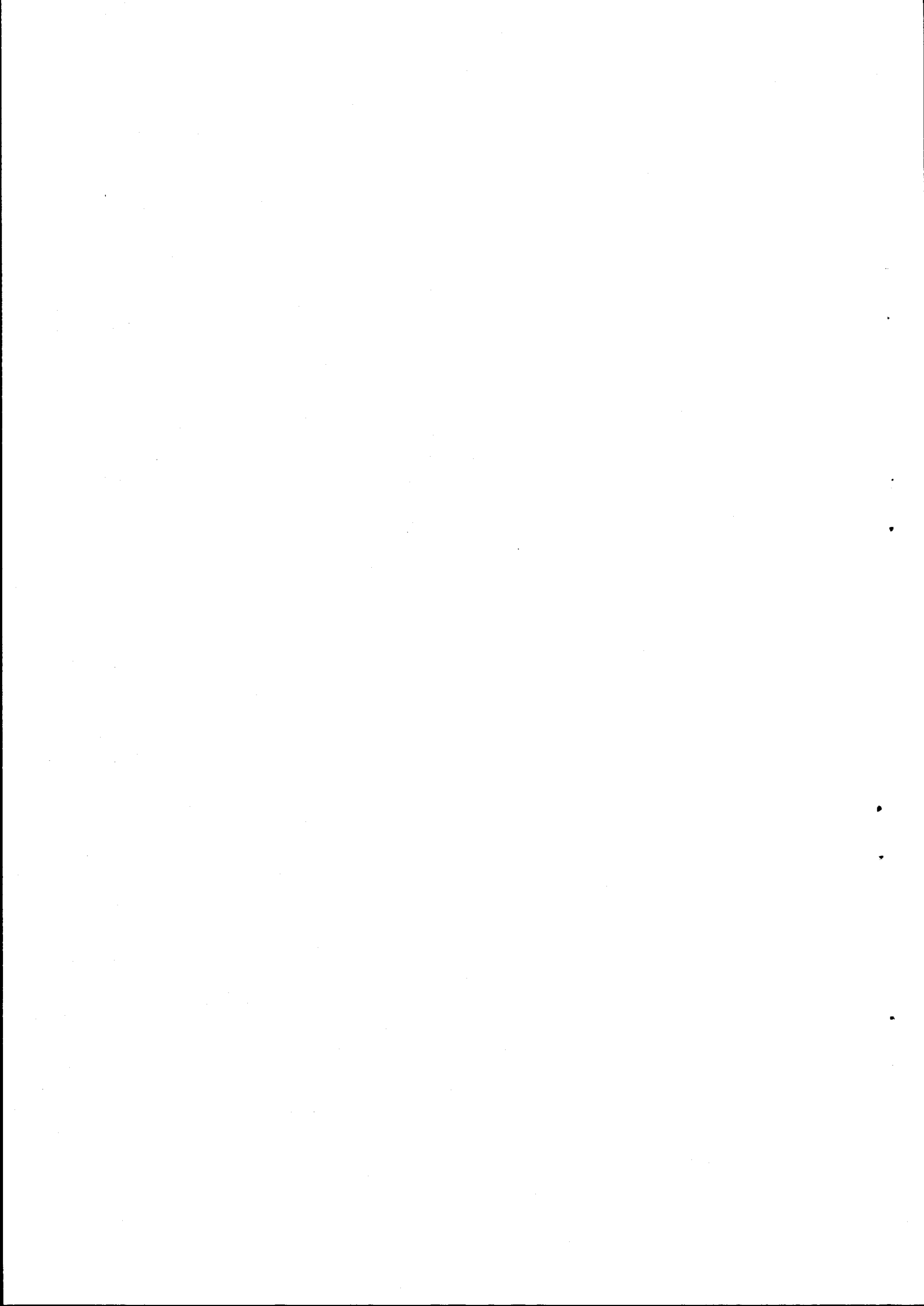
(3) R_4 představuje skupinu obecného vzorce $-NR_{11}R_{12}$, kde každý ze symbolů R_{11} a R_{12} představuje methylskupinu, potom

R_2 nepředstavuje alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je substituovaná jednou monohalogenovanou fenylyskupinou nebo jednou alkylovanou fenylyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části;

a 10 až 99,95 dílu hmotnostního alespoň jednoho zemědělsky přijatelného nosiče nebo pomocné látky.

5. Insekticidní, akaricidní a fungicidní prostředek pro potírání škodlivých organismů podle nároku I, **v y z n a ě u j í c í s e t í m**, že jako účinnou složku obsahuje imidazolový derivát obecného vzorce I, kde R_1 představuje kyanoskupinu; R_2 představuje 4-methylfenylskupinu; R_3 představuje atom chloru a R_4 představuje dimethylaminoskupinu.

Konec dokumentu





CZ 283597B6

Batch : N93036

Date : 30/01/2006

Number of pages : 56

Previous document : CZ 283596B6

Next document : CZ 283598B6