

(19) Országkód

HU



**MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG
ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL**

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám

200600 B

(22) Bejelentés napja: 1988. 12. 29. (21) (6654/88)

Bejelentés elsőbbsége: (33) DE
(32) 1987. 12. 31.
(31) (P 37 44 620.7)

(41) (42) Közzététel napja: 1989. 11. 28.

(45) Megadás meghirdetésének dátuma
a Szabadalmi Közlönyben: 1990. 07. 30.

(51)

Int Cl⁵
CO7D 213/89
AO1N 43/40

(72) (71) Feltaláló(k):
Dr. ZIPPERER, Bernhard, Dirmstein
Dr. BUSCHMANN, Ernst
Dr. LAUER, Manfred
Dr. AMMERMAN, Eberhard, Ludwigshafen/Rhein
Dr. LORENZ, Gisela, Neustadt, DE

(73) (72) (71) Szabadalmaz:
BASF AG., Ludwigshafen/Rhein, DE

(54) PIRIDIN-N-OKIDOKAT TARTALMAZÓ GOMBAÖLŐSZEREK ÉS ELJÁRÁS A HATÓANYAGOK ELŐÁLLÍTÁSÁRA

(57) KIVONAT

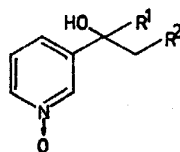
A találmány az (I) általános képletű, új piridin-N-oxid-származékokat hatóanyagként tartalmazó gombaölő készítményekre, valamint a hatóanyagok előállítására vonatkozik.

Az (I) általános képletben

R¹ jelentése alkilcsoport, és

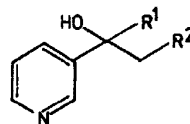
R² egy-két halogénatommal vagy trifluor-metil-csoporttal szubsztituált fenilcsoportot jelent.

Az (I) általános képletű vegyületek előállítására a megfelelő (II) általános képletű piridil-metanol-származékokat oxidálják.



(II)

A leírás terjedelme: 8 oldal, 1 ábra



(III)

HU 200600 B

A találmány tárgya az (I) általános képletű, új piridin-N-oxid-származékokat hatóanyagként tartalmazó gombaölő készítményeket, valamint eljárás a hatóanyagok előállítására.

Ismert, hogy a 3-piridil-metanol-származékoknak fungicid hatásuk van (EP 69 330). Ezek hatása azonban csak nagyobb mennyiségben való felhasználásuk esetén kielégítő.

Azt találtuk, hogy az (I) általános képletű, új piridin-N-oxid-származékok fungicid hatása az ismert hatóanyagoknál nagyobb, és a növények az (I) általános képletű, új vegyületeket lényegesen jobban tűrik, mint az eddig ismert 3-piridil-metanol-származékokat.

Az (I) általános képletben

R¹ jelentése 1–12 szénatomos alkilcsoport, és

R² jelentése egy vagy két halogénatommal vagy trifluor-metil-csoporttal szubsztituált fenilcsoport.

R¹ 1–12, előnyösen 3–8 szénatomos alkilcsoportot, például metil-, etil-, n-propil-, n-butil-, i-butil-, terc-butil-, n-pentil-, i-pentil-, neopentil-, n-hexil-, neohe-xil-, n-heptil-, n-oktil-, n-nonil-, n-decil-, n-undecil- vagy n-dodecil-csoportot jelent.

R² jelenthet például (trifluor-metil)-fenil-, fluor-fenil-, klór-fluor-fenil-, klór-fenil-, diklór-fenil- vagy triklór-fenil-csoportot.

Az (I) általános képletű vegyületeknek legalább egy aszimmetriás szénatomja van, így ezeknek a vegyületeknek optikailag aktív izomerjeik, enantio-merjeik vannak.

Az (I) általános képletű vegyületek tiszta enantio-merjeinek, racemátjainak és diasztereomerjeinek előállítása is a találmány tárgyát képezi.

Az (I) általános képletű piridin-N-oxidszármazékokat például úgy állíthatjuk elő, hogy (II) általános képletű, 3-as helyzetben szubsztituált piridinszármazékokat – a képletben R¹ és R² a fentiekben megadott jelentésű – szokásos módon oxidálunk. Alkalmas oxidálószerként például a persavak, a hidrogén-peroxidból és karbonsavanhidridekből in situ előállított persavak, a hidrogén-peroxid és a hidrogén-peroxid szerves származékai (lásd például: R. A. Abramovitch és E. M. Smith, „Chemistry of Heterocyclic Compounds” 14. kötet, 2. pótkötet, 1. oldaltól, John Wiley, New York 1974; A. R. Katritzky, J. M. Lagowsky, „The Chemistry of Heterocyclic N-Oxides” 21. oldaltól, Academic Press, New York 1971). Ennél az eljárásnál különösen előnyös oxidálószer a 3-klór-

-perbenzoesav [lásd: J. C. Craig, K. K. Purnshotha-man, J. Org. Chem. 35, 1721 (1970)].

A 3-klór-perbenzoesavval végzett oxidációhoz oldószerként például klórozott szénhidrogéneket, főleg diklór-metánt vagy kloroformot használunk.

A (II) általános képletű 3-piridil-metanol-származékok az EP-A-69 330-ból ismertek. Az ott leírt előállítási eljárásokat minden nehézség nélkül alkalmazhatjuk más alkil- vagy arilcsoportok esetén is.

Példák az (I) általános képletű új vegyületek előállítására:

1. példa

1-(2,4-Diklór-fenil)-2-(piridin-1-oxid-3-il)-2-deka-nol

8,5 g (0,022 mól) 1-(2,4-diklór-fenil)-2-(3-piridil)-2-dekanolnak 100 ml diklór-metánnal készült oldatába keverés közben becsepegtetjük 7,6 g (0,044 mól) 3-klór-perbenzoesavnak 60 ml diklór-metánnal készült oldatát. A reakcióelegyet egy éjen át keverjük, majd 5 tömegszázalékos nátrium-hidroxid oldattal kétszer majd vízzel egyszer mossuk, nátrium-szulfáttal szárítjuk és vákuumban bepároljuk. Az olajos bepárlási maradékot diizopropil-éterrel kristályosodásig keverjük. A terméket leszívva és vákuumban szárítva homokszínű porként 6,8 g cím szerinti vegyületet nyerünk (kitermelés: 78 %).

Olvadáspontja: 99–102 °C (1. számú hatóanyag)

2. példa

1-(4-Fluor-fenil)-2-(piridin-1-oxid-3-il)-2-dekanol

7,5 g (0,022 mól) 1-(4-fluor-fenil)-2-(3-piridil)-2-dekanolnak 100 ml diklór-metánnal készült oldatába keverés közben becsepegtetjük 7,6 g (0,044 mól) 3-klór-perbenzoesavnak 60 ml diklór-metánnal készült oldatát. A reakcióelegyet egy éjjel át keverjük, majd térfogatának körülbelül a felére bepároljuk és ezt körülbelül 300 g 1-es aktivitásfokú bázikus alumínium-oxiddal töltött oszlopra visszük fel. A nem poláros szennyezéseket diklór-metánnal, a piridin-N-oxidot pedig diklór-metán/metanol = 3:1 arányú eleggyel eluáljuk. Az eluátumot vákuumban bepárolva sárga olajként 5,5 g cím szerinti vegyületet nyerünk (kitermelés: 70 %).

A piridin-rész ¹H-NMR spektruma (200 MHz, deutero-kloroform): δ = 8,30 (2-H), 8,05 (6-H), 7,20 (4-H, 5-H) (2. számú hatóanyag)

A fenti példákkal analóg módon állíthatjuk elő a következő vegyületeket:

1. táblázat
(I) általános képletű vegyületek

Hatóanyag száma	R ¹	R ²	olvadáspont (°C)
1	n-oktil	2,4-diklór-fenil	99–102
2	n-oktil	4-fluor-fenil	olaj
3	i-propil	4-klór-fenil	
4	i-propil	2-klór-fenil	
5	i-propil	2,4-diklór-fenil	150–151
6	n-propil	2,4-diklór-fenil	
8	n-propil	4-metil-fenil	
9	n-butil	2,4-diklór-fenil	
10	n-butil	4-klór-fenil	
11	i-butil	2,4-diklór-fenil	161

Hatóanyag száma	I. táblázat (I) általános képletű vegyületek		olvadáspont (°C)
	R1	R2	
12	i-butil	4-klór-fenil	
13	i-butil	4-fluor-fenil	
14	i-butil	3-trifluor-metil-fenil	
15	i-butil	2-klór-fenil	
16	n-pentil	4-klór-fenil	
17	n-pentil	2,4-diklór-fenil	
18	n-pentil	2-klór-fenil	
19	neohexil	2-klór-fenil	
20	neohexil	4-klór-fenil	
21	neohexil	2,4-diklór-fenil	150–153
22	neohexil	4-trifluor-metil-fenil	
23	neohexil	3-trifluor-metil-fenil	
24	neohexil	4-fluor-fenil	
26	neohexil	4-klór-3-trifluor-metil-fenil	
27	n-hexil	2,4-diklór-fenil	
28	n-heptil	2,4-diklór-fenil	
29	n-oktil	2-klór-fenil	65–67
30	n-oktil	4-klór-fenil	olaj
31	n-oktil	3-trifluor-metil-fenil	olaj
32	n-nonil	2,4-diklór-fenil	
33	n-decil	2,4-diklór-fenil	
34	n-undecil	2,4-diklór-fenil	
35	n-dodecil	2,4-diklór-fenil	
36	n-doecil	4-klór-fenil	
37	n-dodecil	2-klór-fenil	57–64
38	n-dodecil	4-fluor-fenil	73–76
39	neopentil	2,4-diklór-fenil	
40	neopentil	4-klór-fenil	
41	neopentil	2-klór-fenil	
42	neopentil	4-fluor-fenil	
43	neopentil	2-fluor-fenil	
44	neopentil	4-trifluor-metil-fenil	
45	neopentil	3-trifluor-metil-fenil	

Hatóanyag száma	NMR-adatok és IR értékek
2	¹ H-NMR (CDCl ₃): δ = 8,30 (s, 2'-H), 8,05 (s, 6'-H), 7,20 (széles m, 4'-H, 5'-H), 7,10 (dd, 2H _o), 6,85 (dd, 2H _m), 4,75 (széles s, OH), 3,03 (dd, 1-CH ₂), 1,80 (széles m, 3-CH ₂), 1,20 (széles m, 4-9 CH ₂), 0,85 (t, 10-CH ₂), IR (film): ν = 2953, 2927, 2855, 1601, 1509, 1426, 1298, 1261, 1223, 1158, 1015 cm ⁻¹
30	¹ H-NMR (CDCl ₃): δ = 8,30 (s, 2'-H), 8,05 (s, 6'-H), 7,20 (széles m, 4'-H, 5'-H), 7,15 (d, 2H _o), 6,95 (d, 2H _m), 4,25 (széles s, OH), 3,00 (dd, 1-CH ₂), 1,78 (széles m, 3-CH ₂), 1,20 (széles m, 4-9 CH ₂), 0,85 (t, 10-CH ₃) IR (film): ν = 3223, 2927, 2854, 1602, 1490, 1467, 1428, 1258, 1149, 1093, 1016 cm ⁻¹
31	¹ H-NMR (CDCl ₃): δ = 8,30 (s, 2'-H), 8,05 (s, 6'-H), 7,40–7,15 (m, 4'-H, 5'-H, 2H _o , H _m , H _p), 4,65 (széles s, OH), 3,10 (dd, 1-CH ₂), 1,80 (széles m, 3-CH ₂), 1,20 (széles m, 4-9 CH ₂), 0,85 (t, 10-CH ₂) IR (film): ν = 3220, 2928, 2856, 1602, 1428, 133, 1259, 1204, 1163, 1124, 1096, 1075 cm ⁻¹

A találmány szerinti új vegyületek kitérnek a fitopatogén gombák széles spektruma, főleg a tömlősgombák (*Ascomycetes*) és a bazidiomos gombák (*Basidiomycetes*) osztályába tartozó fitopatogén gombák elleni jó hatásukkal. Az új vegyületek részben szisztémikusan hatásosak, és ezek levél- illetve talaj-fungicid szerek hatóanyagául alkalmazhatók.

A találmány szerinti új vegyületek különösen alkalmasak a következő növényi betegségek leküzdésére:

Erysiphe graminis, gabonán
Erysiphe cichoracearum és Sphaerotheca fuliginosa, tökféléken
Podosphaera leucotricha, almán
Ucinula necator, szőlőn

Puccinia-fajok, gabonán
 Rhizoctonia-fajok, gyapoton és a gyepen
 Ustilago-fajok, gabonán és cukornádon
 Venturia inaequalis, almán
 Helminthosporium-fajok, gabonán
 Septoria nodorum, búzán
 Botrytis cinerea, szamócán és szőlőn
 Cercospora arachidicola, földimogyorón
 Pseudocercospora herpotrichoides, búzán és ár-
 pán
 Pyricularia oryzae, rizsen
 Phytophthora infestans, burgonyán és paradicsomon
 Fusarium- és Verticillium-fajok, különböző növé-
 nyeken
 Plasmopara viticola, szőlőn
 Alternaria-fajok, zöldségen és gyümölcsökön.

A találmány szerinti vegyületeket úgy alkalmazzuk, hogy ezeket a vegyületeket hatóanyagként tartalmazó készítményekkel a növényeket bepermetezzük vagy beporozzuk, illetve a növények magjait kezeljük. A készítményeket a növények illetve magjaik gomba-
 fertőzöttsége előtt vagy után is lehet alkalmazni.

Az új hatóanyagokból a szokásos készítményeket, így oldatokat, emulziókat, szuszpenziókat, porokat, pasztákat és granulátumokat állíthatunk elő. A felhasználási formák teljes mértékben a felhasználás céljához igazodnak; a készítményeknek minden esetben a hatóanyagok finom és egyenletes eloszlását kell biztosítani. A készítményeket ismert módon állítjuk elő, például a hatóanyagok oldószerrel és/vagy hordozóanyaggal való hígításával, adott esetben emulgeálószerrel és diszpergálószerrel alkalmazva, és hígítószerként vizet használva, segédoldószerként más szerves oldószerrel is alkalmazhatunk. Segédanyagokként lényegében a következők szerepelhetnek: oldószer, így aromás vegyületek, például a xilol, klórozott aromás vegyületek, például a klórozott benzolok, a paraffinok, például az ásványolaj-frakciók, alkoholok, például a metanol, butanol, ketonok, például a ciklohexanon, aminok, például az etanol-amin, a dimetil-formamid és a víz; hordozóanyagok, így a természetes kőporok, például a kaolin, agyag, talkum, kréta, a szintetikus kőporok, például a nagyon finom eloszlású kovácsok, szilikátok; emulgeálószer, így a nemionos és anionos emulgeálószer, például a poli(oxi-etilén)-zsírsavak-éterek, az alkilszulfonátok és aril-szulfonátok; diszpergálószer, így a lignin, szulfitszennylúgok és a metil-cellulóz.

A találmány szerinti fungicid készítmények hatóanyag-tartalma általában 0,1–95, előnyösen 0,5–90 tömegszázalék.

A felhasznált mennyiség a kívánt hatás fajtájától függően 0,02–3 kg hatóanyag/ha vagy több. Ezeket a fungicid készítményeket az anyagvédelemben is fel lehet használni, például a Paecilomyces variotii ellen.

A találmány szerinti gombölő készítményeket, illetve az ezekből készíthető közvetlen felhasználásra alkalmas készítményeket, így az oldatokat, emulziókat, szuszpenziókat, porokat, pasztákat vagy granulátumokat a szokásos módon alkalmazzuk, például permetezéssel, porlasztással, szórással, csávázással vagy locsolással.

Példák a gombaölő készítmények előállítására:

I. példa

- 90 tömegrész 5. számú hatóanyagot elkeverünk
 5 10 tömegrész N-metil- α -pirrolidonnal, és így olyan oldatot kapunk, ami a legfinomabb cseppekre eloszlatva alkalmazható.

II. példa

- 20 tömegrész 5. számú hatóanyagot feloldunk 80 tömegrész xilolból, 8–10 mól etilén-oxidnak és 1 mól olajsav-N-monoetanol-amidnak 10 tömegrésznyi reakciótermékéből, 5 tömegrész dodecil-benzolszulfonsav kalciumsóból és 40 mól etilén-oxidnak és 1 mól ricinusolajnak 5 tömegrésznyi reakciótermékéből álló elegyben. A kapott oldatot vízbe öntve és finoman elosztatva vizes diszperziót nyerünk.

III. példa

- 20 tömegrész 5. számú hatóanyagot feloldunk 40 tömegrész ciklohexanonból, 30 tömegrész izobutanolból, 40 mól etilén-oxidnak és 1 mól ricinusolajnak 20 tömegrésznyi reakciótermékéből álló elegyben. A kapott oldatot vízbe öntve és finoman elosztatva vizes diszperziót nyerünk.

IV. példa

- 20 tömegrész 5. számú hatóanyagot feloldunk 25 tömegrész ciklohexanonból, 65 tömegrész 210–280 °C forrásponttartományú ásványolaj-frakcióból és 40 mól etilén-oxidnak és 1 mól ricinusolajnak 10 tömegrésznyi reakciótermékéből álló elegyben. A kapott oldatot vízbe öntve és finoman elosztatva vizes diszperziót nyerünk.

V. példa

- 80 tömegrész 5. számú hatóanyagot 3 tömegrész diizobutil-naftalin- α -szulfonsav nátriumsóval, szulfitszennylúgból származó 10 tömegrész ligninszulfonsav nátriumsóval és 7 tömegrész porított kovácsavval jól elkeverünk és kalapácsos malomban összeőrítjük. A keveréket vízben finoman elosztatva permetlét kapunk.

VI. példa

- 3 tömegrész 5. számú hatóanyagot 97 tömegrész finomszemcsés kaolinnal jól összekeverünk. Így 3 tömegszázalékos hatóanyag-tartalmú porozószer kapunk.

VII. példa

- 30 tömegrész 5. számú hatóanyagot jó összekeverünk 92 tömegrész porított kovácsavval felületére ráporlasztott 8 tömegrész paraffinolajjal. Így jó tapadóképességű készítményt nyerünk.

VIII. példa

- 40 tömegrész 5. számú hatóanyagot jól összekeverünk 10 tömegrész fenolszulfonsav/karbamid/formaldehid kondenzátum nátriumsóval, 2 tömegrész kovácsavval és 48 tömegrész vízzel. Így vízzel hígítható stabil vizes diszperziót kapunk.

IX. példa

- 20 tömegrész 5. számú hatóanyagot jól összeke-

verünk 2 tömegrész dodecil-benzolszulfonsav kalciumsóval, 8 tömegrész zsíralkohol-poli(glikol-éter)-rel, 2 tömegrész fenolszulfonsav/karbamid/formaldehid kondenzátum nátriumsóval és 68 tömegrész paraffinos jellegű ásványolajjal. Így stabil olajos diszperziót kapunk.

A találmány szerinti készítményekben az (I) általános képletű hatóanyagokat más hatóanyagokkal, így például gyomirtó-, rovarirtó-, növekedésszabályzó- és más gombaölő szerekkel vagy akár műtrágyával is össze lehet keverni és együtt kijuttatni. A más gombaölő szerekkel való összekeverés sok esetben a fungicid hatásspektrum kiszélesedését okozza.

A találmány szerinti hatóanyagok például a következő listában felsorolt fungicid hatóanyagokkal kombinálhatók, anélkül azonban, hogy a kombinációs lehetőségeket a felsorolás eseteire korlátoznánk:

Kén
Ditiokarbamatok és származékaik, így
ferri-dimetil-ditiokarbamat,
cink-dimetil-ditiokarbamat,
cink-etilén-bisz-ditiokarbamat,
magnán-etilén-bisz-ditiokarbamat,
mangán-cink-etilén-diamin-bisz-ditiokarbamat,
tetrametil-tiurám-diszulfidok,
cink-(N,N'-etilén-bisz-ditiokarbamat) ammónia
komplexe,
cink-(N,N'-propilén-bisz-ditiokarbamat) ammónia
komplexe,
cink-(N,N'-propilén-bisz-(tiokarbamat),
N,N'-polipropilén-bisz-(tiokarbamoil)-diszulfid;
Nitroszármazékok, így
dinitro-(1-metil-heptil)-fenil-krotonát,
2-szek-butil-4,6-dinitro-fenil-3,3-dimetil-akrilát,
2-szek-butil-4,6-dinitro-fenil-izopropil-karbonát,
5-nitro-izoftálsav-diizopropil-észter;
Heterociklusos vegyületek, így
2-heptadecil-2-imidazolin-acetát,
2,4-diklór-6-(o-klór-anilino)-s-triazin,
O,O-dietil-ftálimido-foszfono-tioát,
5-amino-1-[bisz-(dimetil-amino)-foszfinil]-3-fenil-
-1,2,4-triazol,
2,3-diciano-1,4-ditio-antrakinon,
2-tio-1,3-ditio-(4,5-b)-kinoxalin,
1-(butil-karbamoil)-2-benzimidazol-karbaminsav-
-metil-észter,
2-metoxi-karbonil-amino-benzimidazol,
2-[furil-(2)]-benzimidazol,
2-[tiazolil-(4)]-benzimidazol,
N-(1,1,2,2-tetraklór-etil-tio)-tetrahydroftálimid,
N-triklór-metil-tio-tetrahydroftálimid,
N-triklór-metil-tio-ftálimid,
N-diklór-fluor-metil-tio-N',N'-dimetil-N-fenil-kén-
-sav-diamid,
5-etoxi-3-triklór-metil-1,2,3-tiadiazol,
2-rodán-metil-tio-benzotiazol,
1,4-diklór-2,5-dimetoxi-benzol,
4-(2-klór-fenil-hidrazino)-3-metil-5-izoxazonon,
piridin-2-tio-1-oxid,
8-hidroxi-kinolin illetve réz sója,
2,3-dihidro-5-karboxanilido-6-metil-1,4-oxatiin,
2,3-dihidro-5-karboxamilido-6-metil-1,4-oxatiin-
-4,4-dioxid,
2-metil-5,6-dihidro-4H-pirán-3-karboxi-anilin,

2-metil-furán-3-karboxanilid,
2,5-dimetil-furán-3-karboxanilid,
2,4,5-trimetil-furán-3-karboxanilid,
2,5-dimetil-furán-3-karbonsav-ciklohexil-amid,
N-ciklohexil-N-metoxi-2,5-dimetil-furán-karboxa-
mid,
2-metil-benzoészav-anilid,
2-jód-benzoészav-anilid,
N-formil-N-morfolino-2,2,2-triklór-etil-acetát,
piperazin-1,4-diil-bisz-[1-(2,2,2-triklór-etil)-forma-
mid],
1-(3,4-diklór-anilino)-1-formil-amino-2,2,2-tri-
klór-etán,
2,6-dimetil-N-tridecil-morfolin illetve sói,
2,6-dimetil-N-ciklododecil-morfolin illetve sói,
N-[3-(p-terc-butil-fenil)-2-metil-propil]-cisz-2,6-
-dimetil-morfolin,
N-[3-(p-terc-butil-fenil)-2-metil-propil]-piperidin,
1-[2-(2,4-diklór-fenil)-4-etil-1,3-dioxolán-2-il-etil]-
-1H-1,2,4-triazol,
1-[2-(2,4-diklór-fenil)-4-n-propil-1,3-dioxolán-2-il-
-etil]-1H-1,2,4-triazol,
N-(n-propil)-N-(2,4,6-triklór-fenoxi-etil)-N'-imida-
zolil-karbamid,
1-(4-klór-fenoxi)-3,3-dimetil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-
-il)-2-butanon,
1-(4-klór-fenoxi)-3,3-dimetil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-
-il)-2-butanol,
α-(2-klór-fenil)-α-(4-klór-fenil)-5-pirimidin-metana-
-l,
5-butil-2-dimetil-amino-4-hidroxi-6-metil-pirimi-
din,
bisz-(p-klór-fenil)-3-piridil-metanol,
1,2-bisz-(3-etoxi-karbonil-2-tioureido)-benzol,
1,2-bisz-(3-metoxi-karbonil-2-tioureido)-benzol,
valamint egyéb, különböző fungicid hatóanyagok,
így dodecil-guanidin-acetát,
3-[3-(3,5-dimetil-2-hidroxi-ciklohexil)-2-hidroxi-
-etil]-glutárimid,
hexaklór-benzol,
D,L-metil-N-(2,6-dimetil-fenil)-N-furoil(2)-alani-
nát,
D,L-N-(2,6-dimetil-fenil)-N-(2'-metoxi-acetil)-ala-
nin-metil-észter,
N-(2,6-dimetil-fenil)-N-klór-acetil-D,L-2-amino-
-butirolakton)
D,L-N-(2,6-dimetil-fenil)-N-(fenil-acetil)-alanin-
-metil-észter,
5-metil-5-vinil-3-(3,5-diklór-fenil)-2,4-dioxo-1,3-
-oxazolidin,
3-[(3,5-diklór-fenil)-5-metil-5-metoxi-metil]-1,3-o-
-xazolidin-2,4-dion,
3-(3,5-diklór-fenil)-1-izopropil-karbamoil-hidanto-
-in,
N-(3,5-diklór-fenil)-1,2-dimetil-ciklopropán-1,2-di-
karboximid,
2-ciano[N-(etil-amino-karbonil)-2-metoxi-imino]-
-acetamid,
1-[2-(2,4-diklór-fenil)-pentil]-1H-1,2,4-triazol,
2,4-difluor-a-(1H-1,2,4-triazol-1-il-metil)-benzhi-
d-alkohol.
Hatástani példa:
Összehasonlító hatóanyagként az EP-69 330-ből
ismert 1-(2,4-diklór-fenil)-2-(3-piridil)-3-metil-2-bu-
tanolt használtunk (A hatóanyag).

A Botrytis cinerea elleni hatás

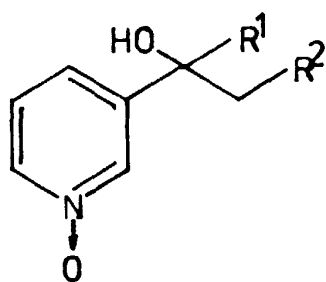
A szabad ég alatti kis parcellákban termesztett „Senga-Sengana” fajtájú szamócákat a fővirágzás idején vizes szuszpenzióval cseppnedvesre permeteztük be. A szuszpenzió szárazanyagtartalmának 80 tömegszázaléka hatóanyag, 20 tömegszázaléka pedig diszpergálószer volt. 2 nap múlva a növényeket a Botrytis cinerea spóráiból készült szuszpenzióval inokuláltuk, majd további öt nap múlva a megfelelő parcellákat mégegyszer kezeltük. Majd 38 nappal ezután az érett gyümölcsöket Botrytis-fertőzöttségre vizsgáltuk meg.

Az eredmény azt mutatja, hogy 2 kg hatóanyag/ha mennyiségben az 5. számú hatóanyagnak jobb fungicid hatása (75 %) van, mint az A összehasonlító hatóanyagnak (18 %).

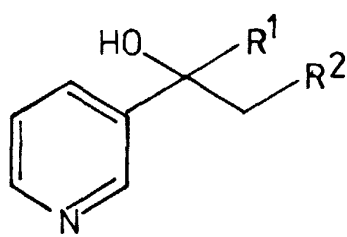
SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Gombaölő készítmény *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként 0,1–95 tömeg % mennyiségben (I) általános képletű piridin-N-oxid-származékot tartalmaz – a képletben
- 5 R^1 jelentése 1–12 szénatomos alkilcsoport, és R^2 egy vagy két halogénatommal vagy trifluor-metilcsoporttal szubsztituált fenilcsoportot jelent – szilárd és folyékony hordozó-, illetve hígítóanyag – előnyösen természetes és mesterséges ásványi őrlemény, alifás, aromás és ciklusos szénhidrogén, víz, ásványolaj-frakció – és felületaktív adalék – előnyösen ionos és nemionos diszpergáló-, emulgeáló- és nedvesítőszer – legalább egyikével együtt.
- 10 2. Eljárás az (I) általános képletű piridin-N-oxid-származékok – a képletben R^1 és R^2 jelentése az 1. igénypontban megadott – előállítására, *azzal jellemezve*, hogy egy (II) általános képletű piridil-metanol-származékot – a képletben R^1 és R^2 a
- 20 fenti jelentésű – oxidálunk.

1/1



(I)



(II)