



Государственный комитет
СССР
по делам изобретений
и открытий

О П И С А Н И Е ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(11) 906346

(61) Дополнительный к патенту -

(22) Заявлено 17.12.79 (21) 2851808/05

(23) Приоритет - (32) 18.12.78

(31) Р 2854598.4 (33) ФРГ

Опубликовано 15.02.82 Бюллетень № 6

Дата опубликования описания 15.02.82

(51) М. Кл.³

A 01 N 37/22
C 07 C 103/30

(53) УДК 632.952
(088.8)

(72) Авторы
изобретения

Иностранцы
Петер Плат, Карл Эйккен, Вольфганг Рор, Бернд Цее
и Эрнст-Гейнрих Поммер
(ФРГ)

(71) Заявитель

Иностранная фирма
"БАСФ АГ"
(ФРГ)

(54) ФУНГИЦИДНОЕ СРЕДСТВО

1

Изобретение относится к химическим средствам защиты растений, а именно к фунгицидному средству на основе анилидов N-азолилалкилкарбоновой кислоты.

Известно фунгицидное средство на основе анилидов карбоновых кислот [1].

Известно также фунгицидное средство, содержащее в качестве действующего начала N (трихлорметилтио)фталимид и вспомогательные компоненты и эмульгатор [2].

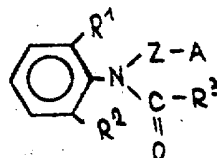
Однако, указанные фунгицидные средства обладают недостаточной активностью при малых концентрациях.

Цель изобретения - изыскание фунгицидных средств, обладающих высокой фунгицидной активностью.

Для достижения поставленной цели используют фунгицидное средство в форме диспергируемого концентрата, содержащего в качестве действующего на-

2

чала анилиды N-азолилалкилкарбоновой кислоты общей формулы



в которой R¹ и R² - одинаковы или различны и означают метил, этил или изопропил;

R³ - дихлорметил, трихлорметил, метилтиометил, этоксиметил, феноксиметил, 4-хлорфенилтиометил, бензоксиметил, 2,4-дихлорфеноксиметил, 2-фторэтил, 1-хлорэтил, 1,1-дихлорэтил, циклопропил, фенил, 4-фторфенил, 4-нитро-

5

10

15

20

фенил, 3-метилфенил, 4-метоксифенил, 4-метилтиофенил, метокси, этокси, изопропилокси, фенокси, тиенил-2, фурил-3;

Z - радикал- CH_2 - или $\text{CH}_3\text{-CH-CH}_2$;

A - пиразол, 3,5-диметилпиразол, имидазол, 4,5-дихлоримидазол, 1,2,4-триазол,

а в качестве эмульгатора - лигнинсульфонат натрия при следующем соотношении компонентов, вес. %:

Действующее начало 80

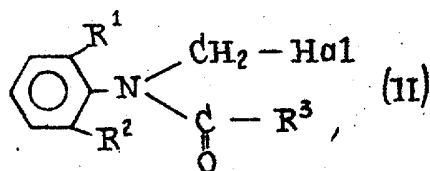
Лигнинсульфонат

натрия

20

Фунгицидное средство готовят обычным смешиванием компонентов.

Соединения формулы I получают взаимодействием анилидов N-галогенметилкарбоновой кислоты формулы



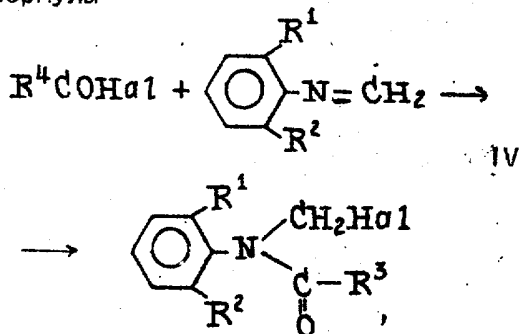
в которой R^1, R^2 и R^3 имеют указанные значения;

NaI - галоген, предпочтительно хлор или бром; в случае необходимости в присутствии разбавителя и связывающего кислоту средства азолами формулы

A - M, III

в которой A имеет указанные значения, M водород или щелочной металл.

Получение анилидов N-галогенметилкарбоновой кислоты формулы II осуществляют путем присоединения галогенида кислоты $R\text{-COHAI}$ к основанию Шиффа формулы



где NaI - галоген, R^1, R^2 и R^3 имеют указанные значения.

Необходимые в качестве исходных материалов основания Шиффа формулы IV могут быть получены известными методами из соответствующих анилинов и параформальдегида в толуоле.

В качестве разбавителей применяют толуол или этиловый эфир уксусной кислоты, а в качестве связывающего кислоту средства - неорганические акцепторы кислоты, такие как щелочные карбонаты, третичные амины или пиридин можно использовать в избытке и соответствующие азолы. Температуры реакции варьируют от -10 до $+150^\circ\text{C}$, предпочитают температуры $20 - 120^\circ\text{C}$.

При получении новых соединений на 1 моль соединения формулы II берут предпочтительно от 1 до 2 моль азола формулы III и 1 моль кислотосвязывателя. Для выделения соединений формулы I реакционную смесь фильтруют, фильтрат промывают водой, высушивают и сгущают. Остаток, в случае необходимости, очищают путем фракционирования ной кристаллизации или дистиллизации.

Таким способом получают следующие соединения, представленные в табл. 1.

Следующие примеры иллюстрируют фунгицидную активность предложенных средств, где A - (трихлорметилтио)фталимид.

Пример 1. 80 вес. % активного ингредиента смешивают с 20 вес. % лигнинсульфоната натрия и получаемое средство переводят в водный препарат, содержащий 0,1 и 0,05% активного ингредиента. Этим препаратом обрызгивают листья растений винограда сорта Мюллер-Тургау. После просыхания жидкого препарата листья поражают суспензией зооспор *Plasmopara viticola*. Растения ставят сначала на 16 ч в насыщенную паром камеру при 20°C и затем на 8 дней в теплицу при $20-30^\circ\text{C}$. По истечении этого времени для ускорения и усиления начала выхода спорангиеносца, растения снова ставят на 16 ч во влажную камеру. Затем на нижней стороне листьев определяют степень поражения листьев по шкале 0-5, причем 0 означает отсутствие поражения, а 5 - полное поражение.

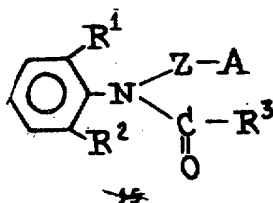
Результаты испытаний представлены в табл. 2.

Пример 2. 80 вес. % активного ингредиента смешивают с 20 вес. % лигнинсульфоната натрия и получаемое средство переводят в водный препарат, со-

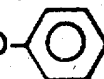
держаний 0,1% активного ингредиента. Этим препаратом обрызгивают листья помидорных растений сорта "Professor Rudloff". После просыхания жидкостного препарата листья заражают суспензией зооспор грибка *Phytophthora infestans*. Растения ставят затем на 16 ч в насыщенную паром камеру при 16-

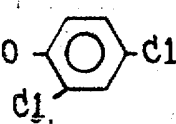
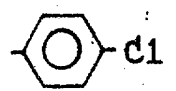
18°C. По истечении 5 дней оценивают фунгицидную активность по шкале, указанной в примере 1. Результаты испытаний представлены в табл. 3.

Таким образом, предлагаемые фунгицидные средства обладают высокой фунгицидной активностью при малых концентрациях.



Т а б л и ц а 1

Активный ингредиент	R ¹	R ²	Z	R ³	A
1	2	3	4	5	6
1	CH ₃	CH ₃	CH ₂	$\begin{array}{c} \text{-CH-CH}_3 \\ \\ \text{Cl} \end{array}$	Имидазол
2	CH ₃	CH ₃	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{-CH-CH}_3 \\ \\ \text{Cl} \end{array}$	1,2,4-Триазол
3	CH ₃	CH ₃	CH ₂	-CHCl ₂	3,5-Диметилпиразол
4	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂	CCl ₃	1,2,4-Триазол
5	CH ₃	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_2- \end{array}$	CH ₂ -O-CH ₃	1,2,4-Триазол
6	CH ₃	CH ₃	CH ₂	-OCH ₃	Имидазол
7	CH ₃	CH ₃	CH ₂	-OCH ₃	1,2,4-триазол
8	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂	-OC ₂ H ₅	1,2,4-Триазол
9	CH ₃	CH ₃	CH ₂	-OC ₃ H ₇ -изо	1,2,4-Триазол
10	CH ₃	CH ₃	CH ₂	-OC ₃ H ₇ -изо	Имидазол
11	CH ₃	CH ₃	CH ₂	$\begin{array}{c} \text{-O-} \end{array}$ 	1,2,4-Триазол
12	CH ₃	CH ₃	CH ₂	-CH ₂ -S-CH ₃	Пиразол
13	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂	-CH ₂ -S-CH ₃	1,2,4-Триазол
14	CH ₃	CH ₃	CH ₂	Циклопропил	1,2,4-Триазол

1	2	3	4	5	6
15	C_2H_5	C_2H_5	CH_2	Циклопропил	1,2,4-Триазол
16	CH_3	CH_3	CH_2	$CH_2-O-C_2H_5$	1,2,4-Триазол
17	CH_3	CH_3	CH_2	CH_2-O-CH_2- 	1,2,4-Триазол
18	CH_3	CH_3	CH_2	CH_2-O- 	Пиразол
19	C_2H_5	C_2H_5	CH_2	$-CH_2-O-$  $-Cl$	4,5-Дихлоримидазол
20	CH_3	CH_3	CH_2	CH_2-S-  $-Cl$	1,2,4-Триазол
21	CH_3	CH_3	CH_2	$-CCl_2-CH_3$	1,2,4-Триазол
22	CH_3	CH_3	CH_2	Фенил	4,5-Дихлоримидазол
23	CH_3	CH_3	CH_2	3-Метилфенил	Имидазол
24	C_2H_5	C_2H_5	CH_2	3-Метилфенил	Имидазол
25	CH_3	CH_3	CH_2	4-Фторфенил	Имидазол
26	C_2H_5	C_2H_5	CH_2	4-Нитрофенил	Имидазол
27	изо- $-C_3H_7$	изо- $-C_3H_7$	CH_2	Фенил	Имидазол
28	изо- $-C_3H_7$	изо- $-C_3H_7$	CH_2	Тиенил-2	1,2,4-Триазол
29	CH_3	CH_3	CH_2	Фурил-3	Имидазол
30	CH_3	CH_3	CH_2	4-Метоксифенил	1,2,4-Триазол
31	CH_3	CH_3	CH_2	4-Метилтиофенил	1,2,4-Триазол
32	CH_3	CH_3	CH_2	$-CH_2-CH_2-$	Имидазол

Т а б л и ц а 2

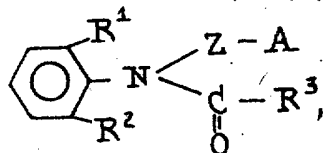
Активный ингредиент	Поражение листьев после опрыски- вания водным препаратом	
	0,1%-ным	0,05%-ным
1	1	2
2	1	2
3	1	2
4	1	2
5	1	2
6	1	2
7	1	2
8	0	1
10	0	0
11	1	2
12	0	1
13	1	2
14	1	2
15	1	2
16	0	0
18	0	0
20	0	1
21	0	1
22	1	2
23	0	0
24	0	0
27	0	1
30	1	2
31	1	2
А Известный	2	3
Контроль (необработанный)	5	5

Т а б л и ц а 3

Активный ингредиент	Поражение листьев после опрыскивания 0,1%-ным водным препаратом
4	2
9	2
10	2
15	2
16	0
17	1
19	0
20	2
25	0
26	1
28	0
29	1
32	1
Контроль (необработанный)	5
А Известный	3

Формула изобретения

Фунгицидное средство в форме диспергируемого концентрата, содержащее действующее начало и эмульгатор, отличающееся тем, что, с целью повышения фунгицидной активности, оно содержит в качестве действующего начала анилиды N-азолилалкил-карбоновой кислоты общей формулы I



пил, фенил, 4-фторфенил, 4-нитрофенил, 3-метилфенил, 4-метоксифенил, 4-метилтиофенил, метокси, этокси, изопропилокси, фенокси, тиенил-2, фурил-3,

Z - радикал - CH_2 или $\text{CH}_2 - \text{CH} - \text{CH}_2 -$

A - пиразол, 3,5-диметилпиразол, имидазол, 4,5-дихлоримидазол, 1,2,4-триазол,

в которой R^1 и R^2 одинаковы или различны и означают метил,

R^3 - дихлорметил, трихлорметил, метоксиметил, метилтиометил, этоксиметил, феноксиметил, 4-хлорфенилтиометил, бензоксиметил, 2,4-дихлорфеноксиметил, 2-фторэтил, 1-хлорэтил, 1,1-дихлорэтил, циклопро-

а в качестве эмульгатора - лигнинсульфонат натрия при следующем соотношении компонентов, вес. %:

Действующее начало	80
Лигнинсульфонат натрия	20

Источники информации,

принятые во внимание при экспертизе

1. Патент Швейцарии № 591205, кл. А 01 N 9/20, опублик. 1977..

2. Мельников Н.Н. Химия и технология пестицидов. М., "Химия", 1974, с. 406-407.

ВНИИПИ Заказ 402/76 Тираж 698 Подписное

Филиал ППП "Патент", г.Ужгород, ул.Проектная, 4