

(19) Országkód:

HU



MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG
ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

205 536 B

(21) A bejelentés száma: 4080/89
(22) A bejelentés napja: 1989. 08. 09.
(30) Elsőbbségi adatok:
P 38 27 134 1988. 08. 10. DE

(51) Int. Cl.⁵

A 01 N 43/28
A 01 N 43/653
C 07 D 405/06
C 07 D 317/14
C 07 D 249/08

(40) A közzététel napja: 1990. 04. 30.
(45) A megadás meghirdetésének dátuma a Szabadalmi
Közlönyben: 1992. 05. 28. SZKV 92/05

(72) Feltalálók:

dr. Elbe, Hans-Ludwig, Wuppertal (DE)
dr. Kranz, Eckart, Wuppertal (DE)
dr. Brandes, Wilhelm, Leichlingen (DE)
dr. Dutzmann, Stefan, Düsseldorf (DE)
dr. Hänssler, Gerd, Leverkusen (DE)

(73) Szabadalmaz:

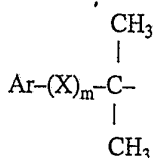
Bayer Ag., Leverkusen (DE)

(54) **Szubsztituált dioxolán-származékokat tartalmazó fungicid készítmény
és eljárás ilyen vegyületek előállítására**

(57) KIVONAT

A találmány (I) általános képletű vegyületeket, vagy azok savaddíciós sóját vagy fémsókomplexét tartalmazó fungicid készítményekre, valamint a hatóanyagok előállítási eljárására vonatkozik. Az (I) általános képletben

R¹ jelentése 1-8 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos cikloalkil-(1-8 szénatomos alkil)-, halogénatommal szubsztituált fenil vagy



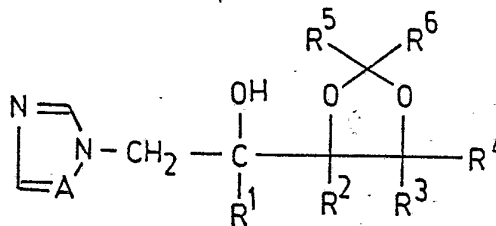
általános képletű csoport, amelyben

Ar jelentése adott esetben halogénatommal, 1-4 szénatomos alkil- vagy halogén-1-4 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált fenilcsoport,

X jelentése -CH₂-csoport, vagy oxigénatom
m jelentése 1,

A jelentése nitrogénatom és

R²-R⁶mindegyikének jelentése hidrogénatom, és R⁵ és R⁶ jelentése lehet még 1-4 szénatomos alkilcsoport is.

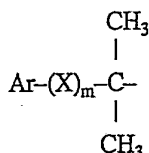


(I)

A találmány tárgya új szubsztituált dioxolán-származékokat tartalmazó fungicid készítmény, valamint eljárás ilyen vegyületek előállítására.

Ismert, hogy bizonyos heterociklusos csoportokkal szubsztituált karbonilszármazékok fungicid hatásúak (például 0055833 számú európai nyilvánosságra hozatali irat, és 4417050 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírás). Így például a 4-(4-klór-fenil)-3,3-dimetil-1-(1,2,4-triazol-1-il)-2-butanol és a (4-klór-fenil)-(5-pirimidinil)-metanol előnyösen alkalmazható különböző gombák ellen. Ezen vegyületek hatása azonban különösen kisebb mennyiségben való alkalmazáskor nem teljesen kielégítő.

Felismertük, hogy az (I) általános képletnek megfelelő szubsztituált dioxolán-származékok, valamint ezek savaddíciós sói, valamint fémsókomplexei kiváló fungicid hatással rendelkeznek. Az (I) általános képletben R^1 jelentése 1–8 szénatomos alkil-, 3–8 szénatomos cikloalkil-(1–8 szénatomos alkil)-, halogénatommal szubsztituált fenil vagy



általános képletű csoport, amelyben

Ar jelentése adott esetben halogénatommal, 1–4 szénatomos alkil- vagy halogén-1–4 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált fenilcsoport,

X jelentése $-\text{CH}_2$ -csoport, vagy oxigénatom

m jelentése 1,

A jelentése nitrogénatom és

R^2 – R^6 mindegyikének jelentése hidrogénatom, és

R^5 és R^6 jelentése lehet még 1–4 szénatomos alkilcsoport is.

A (I) általános képletű vegyületek az R^1 – R^6 szubsztituensek jelentésétől függően két vagy három aszimmetrikus szénatomot is tartalmazhatnak, és ily módon optikai izomerek vagy diasztereomerek formájában is előfordulhatnak.

A találmány szerinti készítmények ennek megfelelően a tiszta izomereket, valamint azok keverékeit is tartalmazhatják hatóanyagként.

A találmány szerinti eljárással az (I) általános képletű vegyületeket, valamint savaddíciós sókat és fémsókomplexeiket úgy állítjuk elő, hogy egy (II) általános képletnek megfelelő vegyületet – a képletben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 és R^6 jelentése a fenti – egy (III) általános képletű vegyülettel – a képletben A jelentése a fenti – reagáltatunk, adott esetben hígítószer és adott esetben valamely, reakció lefutását segítő szer jelenlétében, majd kívánt esetben a kapott vegyületet savaddíciós sóvá vagy fémsókomplekszé alakítjuk.

A (I) általános képletű vegyületeknek, valamint savaddíciós sóiknak és fémsókomplexeiknek kiváló fungicid hatásuk van.

Meglepetésszerűen azt tapasztaltuk, hogy az (I) általános képletű szubsztituált dioxolán-származékok fun-

gicid hatása jelentősen felülmúlja a hasonló szerkezetű és hatású ismert vegyületek hatását, így például a 4-(4-klór-fenil)-3,3-dimetil-1-(1,2,4-triazol-1-il)-2-butanol és (4-klór-fenil)-(5-pirimidinil)-metanol hatását.

A találmány szerinti (I) általános képletben az alkilcsoportok egyenes vagy elágazó szénláncú, 1–8 szénatomos, előnyösen 1–7 szénatomos, még előnyösebben 3–7 szénatomos alkilcsoportot jelentenek.

A cikloalkilcsoport általában 3–7, előnyösen 3–6 szénatomosak.

Előnyösek továbbá a fenti (I) általános képletű dioxolán-származékok savaddíciós sói. Ezen savaddíciós sókat például a következő savak alkalmazásával állíthatjuk elő: hidrogén-halogenidek, így például sósav vagy hidrogén-bromid, foszforsav, salétromsav, kénsav, 1-, 2- és 3-értékű karbonsavak és hidroxikarbonsavak, így például ecetsav, maleinsav, borostyánkősav, fumársav, borkősav, citromsav, szalicilsav, szorbinsav vagy tejsav, szulfonsavak, így például p-toluolszulfonsav vagy 1,5-naftalin-diszulfonsav, valamint szacharin vagy tioszacharin.

Előnyösek továbbá a fenti (I) általános képletű vegyületek, és a periódusos rendszer II–IV főcsoportjába és az I és II, valamint a IV–VIII mellékcsoportjába tartozó fémek sóival képzett komplexei is. Ezen vegyületek előállításához előnyösen réz-, cink-, mangán-, magnézium-, ón-, vas- és nikkelsókat alkalmazunk, amely sóknál anionként előnyösen azok az anionok jönnek számításba, amelyeket az előzőekben felsorolt savakból lehet levezetni, különösen előnyösen a sósavból, hidrogén-bromidból, salétromsavból és kénsavból.

Ha a találmány szerinti eljárásnál kiindulási anyagként például 2-terc-butil-2-(2,2-dimetil-1,3-dioxolán-4-il)-oxiránt és 1,2,4-triazolt alkalmazunk kiindulási anyagként, a reakció az A reakcióvázlat szerint megy végbe.

A reakciónál kiindulási anyagként alkalmazott oxiranil-dioxolán-vegyületet a (II) általános képlettel írjuk le, amely képletben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 és R^6 jelentése előnyösen az előzőekben a (I) általános képletű vegyületnél megadott jelentésekkel azonos.

A (II) általános képletnek megfelelő oxiranil-dioxolán-vegyületek részben ismertek (például Acta Chem. Scand. B 34, 41–45, (1980); Tetrahedron 36, 3101–3105 (1980); Tetrahedron Lett. 27, 69–70 (1986); 62/26 280 számú japán szabadalmi leírás).

A (II) általános képletű vegyületek közé tartozó új vegyületeket a (IIa) képlettel írjuk le, amely képletben Ar jelentése adott esetben a fentiek szerint szubsztituált fenilcsoport,

X jelentése oxigénatom vagy $-\text{CH}_2$ -csoport,

m jelentése 1,

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 és R^6 jelentése a fenti.

A (IIa) általános képletű új oxiranil-dioxolán-vegyületeket az ismert (II) általános képletnek megfelelő oxiranil-dioxolán-vegyületekhez hasonlóan állítjuk elő oly módon, hogy egy (IVa) általános képletnek megfelelő vinil-ketont – a képletben

Ar, X, R^2 , R^3 , R^4 és m jelentése a fentiekben a (IIa) általános képletű vegyületnél megadott jelentésekkel azonos –

egy oxidálószerrel, így például perecetsavval vagy m-klor-perbenzoosavval reagáltatunk, adott esetben hígítószer, így például diklór-metán, diklór-benzol, toluol vagy ecetsav jelenlétében, 10 °C és 60 °C közötti hőmérsékleten, a kapott (V) általános képletnek megfelelő oxiranil-ketont – a képletben

Ar, X, R², R³, R⁴ és m jelentése a fentiekben a (IIa)

általános képletnél megadott jelentésekkel azonos – egy második lépésben egy (VI) általános képletnek megfelelő aldehiddel vagy ketonnal – a képletben

R⁴ és R⁶ jelentése a fenti –

reagáltatunk, adott esetben katalizátor, így például óntetraklorid és adott esetben hígítószer, így például széntetraklorid jelenlétében, –80 és +80 °C közötti hőmérsékleten, majd az ily módon nyert (VIIa) általános képletű vegyületet – a képletben

Ar, X, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ és m jelentése a (IIa) általános

képletnél fentiekben megadott jelentésekkel azonos – vagy egy (VIII) általános képletű dimetil-oxo-szulfónium-metilid vegyülettel reagáltatunk ismert módon hígítószer, így például dimetil-szulfoxid jelenlétében, 20 és 80 °C közötti hőmérsékleten, vagy egy (IX) képletnek megfelelő trimetil-szulfónium-metil-szulfáttal reagáltatjuk ismert módon hígítószer, így például acetonitril és bázis, így például nátrium-metilát jelenlétében, 0 és 60 °C közötti hőmérsékleten.

A fentiekben említett reakciókat a következő irodalmi helyeken ismertetik: a (Va) és a (VI) általános képletű vegyületek leírása: *Angew. Chem. Int. Ed. Engl.* 21, 449 (1982); a (VIIa) és (VIII) képletű vegyületek reakciója: *J. Amer. Chem. Soc.* 87, 1363–1364 (1985); és a (VIIa) és (IX) általános képletű vegyületek reagáltatása: *Heterocycles* 8, 397 (1977).

A fentiek szerint előállított (II) általános képletnek megfelelő oxiranil-dioxolán-vegyületeket izolálás nélkül alkalmazzuk a találmány szerinti eljárásnál.

A (IV) általános képletű vinil-ketonok ismertek vagy ismert eljárásokkal analóg módon állíthatók elő [6718. számú európai szabadalmi leírás; 2922070 számú német szövetségi köztársaságbeli nyilvánosságra hozatali irat; *Chem. Lett.* 1987, 1283–1286; *J. Amer. Chem. Soc.* 108, 4568–4580 (1986); *J. org. Chem.* 51, 2389–2391 (1986) vagy *An. Quim.* 75, 707-711 (1979) és *CA* 92: 75 727a].

Az (Va) általános képletű oxiranil-ke-tonok és a (VIIa) általános képletű dioxolanil-ke-tonok új vegyületek.

A (VII) általános képletnek megfelelő dioxolanil-ke-ton-vegyületek – a képletben

R¹, R², R³, R⁴, R⁵ és R⁶ jelentése a fenti –

részben ismertek [*J. org. Chem.* 33, 2473–2477 (1968); *Acta Chem. Scand. B* 34, 41–45 (1980); *Tetrahedron* 36, 3101–3105 (1980); *J. org. Chem.* 47, 3289–3296 (1982); *Tetrahedron Lett.* 23, 4369–4370 (1982); *Synthesis* 1986 60–61; *Synth. Commun.* 16, 1517–1522 (1986); *Tetrahedron Lett.* 28, 383–386 (1987)], vagy ismert eljárásokkal analóg módon állíthatók elő, például oly módon, hogy egy (X) általános képletű dioxolanil-karbinolt – a képletben

R¹, R², R³, R⁴, R⁵ és R⁶ jelentése a fenti –

ismert módon oxidálunk, például króm-trioxid alkal-

mazásával, piridin és sósav, valamint adott esetben hígítószer, így például diklór-metán, jelenlétében –20 és +80 °C közötti hőmérsékleten [*Tetrahedron Lett.* 28, 383–386 (1987)].

5 A (X) általános képletű dioxolanil-karbinol-vegyületek ismertek, vagy ismert eljárásokkal analóg módon állíthatók elő [pl. *Tetrahedron Lett.* 26, 5759–5762 (1905)].

A (VIIb) általános képletű dioxolanil-ke-ton-vegyületeket – a képletben

10 R¹, R⁵ és R⁶ jelentése a fenti –

úgy állítjuk elő, hogy egy (XI) általános képletű vegyületet – a képletben

R¹ jelentése a fenti és

15 Hal jelentése halogénatom, előnyösen klór- vagy bróm-atom –

formaldehiddel reagáltatunk hígítószer, így például metanol, tetrahydrofuran vagy dioxán és adott esetben reakciólefutást elősegítő szer, így például nátrium-metilát vagy nátrium-hidroxid jelenlétében, 0 °C és 20 120 °C közötti hőmérsékleten, amikor is a reakcióidőtől, a reakció-hőmérséklettől, és a reakció lefutását elősegítő szer koncentrációjától függően vagy egy (XII) általános képletnek megfelelő alfa-halogén-ke-ton – a képletben

25 R¹ és Hal jelentése a fenti –

vagy egy (Vb) általános képletnek megfelelő oxiranil-ke-ton – a képletben

R¹ jelentése a fenti –

30 nyerünk, majd az így nyert (XII) általános képletű α -halogén-ke-ton vagy az (Vb) általános képletű oxiranil-ke-ton vagy ezen vegyületek keverékét egy második lépésben egy (VI) általános képletű aldehiddel vagy ketonnal – a képletben

R⁵ és R⁶ jelentése a fenti –

35 reagáltatunk, adott esetben hígítószer, így például széntetraklorid és adott esetben katalizátor, így például óntetraklorid és adott esetben savmegkötő szer, így például nátrium-metilát vagy nátrium-hidroxid jelenlétében, –80 és +80 °C közötti hőmérsékleten [például *Angew. Chem. Int. Ed. Engl.* 21, 449 (1982)].

40 A (VI) általános képletnek megfelelő aldehidek és ke-tonok a szerves kémia ismert vegyületei.

A (XI) általános képletnek megfelelő halogén-metil-ke-tonok szintén ismert vegyületek, vagy ismert eljárásokkal analóg módon állíthatók elő.

45 A (Vb) általános képletű oxiranil-ke-tonok részben ismert vegyületek [például *Can. J. Chem.* 62, 2429–2434 (1984); *Tetrahedron* 40, 1381–1390 (1984); *Chem. Lett.* 1982, 1601–1604; *J. org. Chem.* 45, 3407–3413 (1980); *J. org. Chem.* 43, 1323–1327 (1978); *Chem. Ber.* 108, 2391–2396 (1975); *J. org. Chem.* 39, 388–393 (1974)].

55 A (XII) általános képletű α -halogén-ke-tonok részben ismert vegyületek [például *Tetrahedron Lett.* 28, 383–386 (1987); *Synth. Commun.* 16, 1517–1522 (1986); *Synthesis* 1986, 60–61; *Tetrahedron Lett.* 23, 4369–4370 (1982); *J. org. Chem.* 47, 3289–3296 (1982); *Tetrahedron* 36, 3101–3105 (1980); *Acta Chem. Scand. B* 34, 41–45 (1980); *J. org. Chem.* 33, 2473–2477 (1968)].

Az eddig még nem ismert α -halogén-ke-ton vegyületeket a (XIIa) általános képlettel írjuk le – amely képletben

Hal jelentése halogénatom, előnyösen klór- vagy bróm-atom, és

Ar, X és m jelentése a fenti.

Ezen vegyületeket úgy állítjuk elő, hogy egy (XIa) általános képletű halogén-metil-ke-ton – a képletben

Ar, X, Hal és m jelentése a fenti –

formaldehiddel reagáltatunk, adott esetben hígítószer, így például metanol, etanol, tetrahydrofuran vagy dioxán, és adott esetben reakciólefutást elősegítő szer, így például nátrium-metilát jelenlétében, 0 °C és 60 °C közötti hőmérsékleten.

A (XIa) általános képletű halogén-metil-ke-tonok ismertek, vagy ismert eljárásokkal analóg módon állítjuk elő (például 2632603, 3021516 számú német szövetségi köztársaságbeli nyilvánosságra hozatali iratok, 54865 számú európai szabadalmi bejelentés).

(VIIc) általános képletű dioxolanil-ke-tonokat – a képletben

R¹ jelentése a fenti –

úgy állítjuk elő, hogy egy (XI) általános képletű halogén-metil-ke-ton – a képletben

R¹ jelentése a fenti és

Hal jelentése halogénatom, előnyösen klór- vagy bróm-atom –

legalább két ekvivalens formaldehiddel reagáltatunk, adott esetben hígítószer, így például metanol vagy tetrahydrofuran, és adott esetben savmegkötőszer, így például nátrium-metilát vagy nátrium-hidroxid jelenlétében, 20 és 80 °C közötti hőmérsékleten, amikor is a keletkező (XII) általános képletű α -halogén-ke-ton in-termediert nem izoláljuk.

A találmány szerinti eljáráshoz még szükséges azol kiindulási vegyületeket a (III) általános képlettel írjuk le. A (III) általános képletben

A jelentése előnyösen azonos a fentiekben a (I) általános képletnél előnyösként megadott jelentésekkel.

A (III) általános képletű azolok a szerves kémia ismert vegyületei.

A találmány szerinti eljárásnál hígítószerként bármely inert szerves oldószert alkalmazhatunk, így például a következő vegyületeket: alifás, aliciklusos vagy aromás, adott esetben halogénezett szénhidrogének, így például benzol, toluol, xilol, klór-benzol, petroléter, hexán, ciklohexán, diklór-metán, kloroform, szén-tetraklorid, éterek, így például dietil-éter, dioxán, tetrahydrofuran, vagy etilén-glikol-dimetil- vagy dietil-éter, ke-tonok, így például acetone vagy butanon; nitrilek, így például acetonitril vagy propionitril, amidok, így például dimetil-formamid, dimetil-acetamid, N-metil-formanilid, N-metil-pirrolidon vagy hexametil-foszforsav-triamid, észterek, így például ecetsav-etilészter, szulfoxidok, így például dimetil-szulfoxid vagy alkoholok, így például metanol, etanol, propanol, butanol, metoxi-etanol vagy etoxi-etanol.

A találmány szerinti eljárást előnyösen alkalmas reakciólefutást elősegítő szerek jelenlétében végezzük. Erre a célra bármely ismert szerves

bázis felhasználható, előnyösen például a következőket alkalmazzuk: alkálifém-hidridek, -hidroxidok, -amidok, -alkoholátok, -karbonátok vagy -hidrogén-karbonátok, így például nátrium-hidrid, nátrium-amid, nátrium-hidroxid, nátrium-metilát, nátrium-etilát, kálium-terc-butilát, nátrium-karbonát vagy nátrium-hidrogén-karbonát, továbbá terciér aminok, így például trietil-amin, N,N-dimetil-anilin, piridin, N,N-dimetil-amino-piridin, diazabiciklo-oktán (DABCO), diazabiciklononén (DBN) vagy diazabiciklo-undecén (DBU).

Előnyösen alkalmazunk továbbá a reakciónál katalitikus mennyiségben ismert gyökkepző anyagokat, így például, α,α' -azo-diizobutiro-nitrilt (AIBN).

A reakció-hőmérséklet a találmány szerinti eljárásnál széles határok között változhat, általában 0 és 200 °C, előnyösen 60 és 150 °C közötti hőmérsékleten dolgozunk, általában normál nyomáson, de emelt vagy csökkentett nyomáson is dolgozhatunk.

A találmány szerinti eljárásnál 1 mól (II) általános képletű oxiranil-dioxolánt általában 1–5 mól, előnyösen 1–1,2 mól (III) általános képletű azollal reagáltatunk, adott esetben 1–5 mól, előnyösen 1–2 mól reakciólefutást elősegítő szer jelenlétében.

A reakciókörülmények, valamint a kapott termék feldolgozása és izolálása ismert módon történik (lásd például az előállítási példákat).

Az (I) általános képletű vegyületek savaddíciós sóit ismert módon, szokásos sóképzési eljárások szerint állítjuk elő, például úgy, hogy egy (I) általános képletű vegyületeket alkalmas inert oldószerekben feloldunk, hozzáadjuk a savat, így például sósavat, majd a kapott vegyületet ismert módon, például szűréssel elválasztjuk, és inert szerves oldószerekkel mossuk.

Az (I) általános képletű vegyületek fémsókomplexeit szintén ismert módon egyszerű eljárások szerint állítjuk elő, például oly módon, hogy a fémsót feloldjuk alkoholban, így például etanolban, majd hozzáadjuk az (I) általános képletű vegyületet, és a kapott fémsókomplext ismert módon, például szűréssel elválasztjuk, és adott esetben átkristályosítással tisztítjuk.

Az (I) általános képletnek megfelelő vegyületeket közítermékként is alkalmazhatjuk további hatóanyagok előállításához.

Ily módon például a hidroxilcsoportot ismert módon alkil-halogenidekkel vagy alkil-szulfátokkal vagy acil-halogenidekkel vagy karbamoi-halogenidekkel alkilezhetjük vagy acilezhetjük, amikor is étereket, észtereket, karbonátokat, vagy karbamátokat kapunk, amelyek ugyancsak hatásos fungicidek.

Az (I) általános képletű vegyületek jelentős hatással rendelkeznek nem kívánt mikroorganizmusokkal szemben, ennek megfelelően ezek az anyagok hatóanyagként alkalmazhatók növényvédőszerekben, különösen fungicidekben.

A találmány szerinti fungicid szerek például a következő mikroorganizmusok ellen alkalmazhatók a növényvédelemben: Plasmodiophoromycetes, Oomyce-tes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes, Deuteromycetes.

A korlátozás szándéka nélkül a következőkben fel-

sorolunk néhány gombás megbetegedést okozó kártevőt, amelyek a fentiekben felsorolt mikroorganizmusok közé tartoznak:

Pythium-fajok, így például *Pythium ultimum*;

Phytophthora-fajok, így például *Phytophthora infestans*;

Pseudoperonospora-fajok, így például *Pseudoperonospora humuli* vagy *Pseudoperonospora cubensis*;

Plasmopara-fajok, így például *Plasmopara viticola*;

Peronospora-fajok, így például *Peronospora pisi* vagy *Peronospora brassicae*;

Erysiphe-fajok, így például *Erysiphe graminis*;

Sphaerotheca-fajok, így például *Sphaerotheca fuliginea*;

Podosphaera-fajok, így például *Podosphaera leucotricha*;

Venturia-fajok, így például *Venturia inaequalis*;

Pyrenophora-fajok, így például *Pyrenophora teres* vagy *Pyrenophora graminea*

(konidium-forma: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);

Cochliobolus-fajok, így például *Cochliobolus sativus* (konidium-forma: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);

Uromyces-fajok, így például *Uromyces appendiculatus*;

Puccinia-fajok, így például *Puccinia recondita*;

Tilletia-fajok, így például *Tilletia caries*;

Ustilago-fajok, így például *Ustilago nuda* vagy *Ustilago avenae*;

Pellicularia-fajok, így például *Pellicularia sasakii*;

Pyricularia-fajok, így például *Pyricularia oryzae*;

Fusarium-fajok, így például *Fusarium culmorum*;

Botrytis-fajok, így például *Botrytis cinerea*;

Septoria-fajok, így például *Septoria nodorum*;

Leptosphaeria-fajok, így például *Leptosphaeria nodorum*;

Cercospora-fajok, így például *Cercospora canescens*;

Alternaria-fajok; így például *Alternaria brassicae*;

Pseudocercospora-fajok, így például *Pseudocercospora herpotrichoides*.

Az (I) általános képletű hatóanyagok igen jól elviselhetők a növények számára a gombás megbetegedések leküzdéséhez alkalmazott koncentrációk esetében, és ennek megfelelően alkalmazhatók a talaj feletti növényi részek, valamint a vetőmagok, palánták és talaj kezelésére egyaránt.

A találmány szerinti készítmények különösen jó eredménnyel alkalmazhatók különböző gabonabetegségek esetében, így például *Erysiphe graminis* (gabonáliszharmat), *Puccinia recondita* (barnarothadás bűzánál), *Leptosphaeria nodorum*, *Pyrenophora teres* (árpa levélfoltosság), *Cochliobolus sativus* (árpa és búza bana levélfoltosság) esetében, továbbá rizsbetegségek, például *Pyricularia oryzae*, valamint különböző gyümölcs- és zöldségfélék károkozói, így például *Botrytis cinerea* vagy *Venturia inaequalis* esetében.

Az (I) általános képletnek megfelelő fungicid hatóanyagok *in vitro* is igen hatásosak.

Az (I) általános képletű vegyületeket fizikai

és/vagy kémiai tulajdonságaiktól függően a szokásos készítmények formájában formulázzuk, így például oldat, emulzió, szuszpenzió, por, hab, paszta, granulátum, aeroszol készítményeket állítunk elő, továbbá a vetőmagok kezeléséhez polimer anyagok alkalmazásával finomkapszulákat, és borító masszákat, valamint ULV-hideg és -meleg ködkészítményeket is előállíthatunk.

Ezeket a készítményeket ismert módon állítjuk elő, például oly módon, hogy a hatóanyagot a szükséges szaporítóanyaggal, folyékony oldószerezrel, nyomás alatt cseppfolyósított gázzal és/vagy szilárd hordozóanyaggal elkeverjük, adott esetben felületaktív anyagok, emulgeálószeres és/vagy diszpergálószeres és/vagy habképző szerek jelenlétében. Amennyiben szaporítóanyagként vizet alkalmazunk, a víz mellett segédoldószerként még szerves oldószert is alkalmazhatunk. Folyékony oldószerként például a következő anyagok alkalmazhatók: aromás szénhidrogének, így például xilol, toluol vagy alkil-naftalin; klórozott aromás vagy klórozott alifás szénhidrogének, így például klór-benzol, klór-etilén vagy metilén-klorid; alifás szénhidrogének, így például ciklohexán vagy paraffinok; például ásványolaj-frakciók, alkoholok, így például butanol vagy glikol, valamint ezek étere és észterei, ketonok, így például aceton, metil-etil-keton, metil-izobutil-keton vagy ciklohexanon, erősen poláros oldószerek, így például dietil-formamid vagy dimetil-szulfoxid valamint víz. Cseppfolyósított gázformájú hordozóanyagok alatt olyan folyadékokat értünk, amelyek normál hőmérséklet és normál nyomás alatt gázformájúak, így például különböző aeroszol-vivőgázok, így például halogén-szénhidrogének, valamint bután, propán, nitrogén- és szén-dioxid. Szilárd hordozóanyagként például a következőket alkalmazhatjuk: agyagok, talkum, kréta, kvarc, attapulgit, montmorillonit vagy diatómaföld, továbbá ezeknek megfelelő szintetikus készítmények, például nagy diszperzitású kovasav, alumínium-oxid és szilícium-dioxid. A granulátumok előállításához szilárd hordozóanyagként például a következőket alkalmazhatjuk: porított és frakcionált természetes kőzetek, így például kalcit, márvány, gipsz, szepiolit, dolomit, valamint szerves és szerves örleményekből készült szintetikus granulátumok, valamint szerves anyagokból, így például fűrészporból, kókuszdióhéjból, kukoricaszárbból és dohányszárbból készült granulátumok. Emulgeáló és/vagy habképző szerként például a következő anyagokat alkalmazhatjuk: nemionos és anionos emulgeátorok, így például poli(etilén-oxi)-zsírsav-észter, poli(etilén-oxi)-zsíralkohol-éter, így például alkil-aril-poliglikol-éter, alkil-szulfonátok, alkil-szulfátok, aril-szulfonátok valamint fehérje-hidrolizátumok. Diszpergálószerként például lignin-szulfid-szennylúgot vagy metil-cellulózt alkalmazunk.

A találmány szerinti készítmények előállításánál ragasztószerként például karboxi-metil-cellulózt, természetes és szintetikus porított vagy szemcsés vagy latex formájú polimereket, így például gumiarábikumot, poli(vinil-alkohol), poli(vinil-acetátot), valamint természetes foszfolipideket, így például kefalint vagy leci-

tint, továbbá szintetikus foszfolipideket alkalmazhatunk. Ásványi vagy növényi olajokat is alkalmazhatunk további adalékanyagként.

Színezékanyagként szerves pigmenteket, például vas-oxidot, titán-oxidot, ferro-cián-kéket, és szerves színezékanyagokat, így például alizarin-, azo- és fémtalocianin színezékeket alkalmazunk, továbbá nyomelemként például vas-, mangán-, bór-, réz-, kobalt-, molibdén- és cinksókat alkalmazunk.

A találmány szerinti készítmények általában 0,1–95 tömeg%, előnyösen 0,5–90 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak.

A találmány szerinti hatóanyagokat a készítményekben más ismert hatóanyagokkal, például fungicidekkel, inszekticidekkel, akaricidekkel, valamint herbicidekkel, továbbá műtrágyákkal vagy növényi növekedést szabályozó anyagokkal is összekeverhetjük.

A találmány szerinti készítményeket közvetlenül vagy a belőlük készített felhasználásra kész oldatok, szuszpenziók, permetporok, paszták, oldható porok, porozószerke vagy granulátumok formájában visszük fel. A felvitelt ismert módon, például öntéssel, permetezéssel, szétszórással, porozással, porzással, habosítással végezhetjük. Lehetséges továbbá, hogy a hatóanyagokat ULV-készítmények formájában vigyük fel, vagy pedig a hatóanyag-készítményeket közvetlenül a talajba is injektálhatjuk. A kezelést közvetlenül a vetőmagok, vagy növények kezelésével is végezhetjük.

A növényi részek kezelésénél a hatóanyag-koncentráció széles határok között változhat, általában 1–0,0001 tömeg%, előnyösen 0,5–0,001 tömeg% közötti koncentrációkat alkalmazunk.

A vetőmagok kezelésénél a hatóanyag mennyisége általában 0,001–50 g, előnyösen 0,01–10 g vetőmag kg-onként.

A talaj kezelésénél a hatóanyag-koncentráció 0,000 01–0,1 tömeg%, előnyösen 0,0001–0,02 tömeg% az alkalmazás helyén.

Előállítási példák.

I példa

(I/1) képletű vegyület előállítása

12,4 g (0,062 mól) 2-terc-butil-2-(2,2-dimetil-1,3-dioxolán-4-il)-oxiránt, 5,1 g (0,074 mól) triazol és 3 g (0,074 mól) nátrium-hidroxidot 60 ml dimetil-formamidban oldunk, és 10 órán át 100 °C hőmérsékleten keverjük. A reakciókeveréket ezután lehűtjük, vízbe öntjük, etil-acétáttal extraháljuk, a szerves fázist vízzel mossuk, nátrium-szulfáton szárítjuk és vákuumban betöményítjük, majd a visszamaradó anyagot kromatografáljuk (szilikagél, etil-acetát/ciklohexán = 3 : 1).

Ily módon 4,4 g (26%) 2,2-dimetil-1-(2,2-dimetil-1,3-dioxolán-4-il)-1-(1,2,4-triazol-1-il-metil)-propán-1-olt nyerünk olajos anyag formájában, törésmutatója: n_D^{20} : 1,4890.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /tetrametil-szilán): δ = 1,00 (s, 9H), 1,30 (s, 3H), 1,31 (s, 3H) ppm.

Kiindulási anyagok előállítása

II-1 példa

(I/2 képletű vegyület)

17,6 g (0,08 mól) trimetil-oxoszulfónium-jodidot elkeverünk 17,5 g (0,22 mól) dimetil-szulfoxiddal, és szobahőmérsékleten hozzáadunk 9 g (0,08 mól) kálium-terc-butilátot, a kapott anyagot 6 órán át szobahőmérsékleten keverjük, majd keverés közben cseppenként hozzáadagolunk 13 g (0,0698 mól) 4-(2,2-dimetil-propanoil)-2,2-dimetil-1,3-dioxolánt, és további 8 órán át szobahőmérsékleten, majd 1 órán át visszafolyatás közben keverjük. Ezután a reakciókeveréket lehűtjük, vízbe öntjük, diklór-metánnal extraháljuk, a szerves fázist vízzel mossuk, nátrium-szulfáton szárítjuk és vákuumban betöményítjük. Ily módon 12,4 g (89%) 2-terc-butil-2-(2,2-dimetil-1,3-dioxolán-4-il)-oxiránt nyerünk, törésmutató: n_D^{20} = 1,4519.

VII-1 példa

(I/3. képletű vegyület)

5,8 g (0,1 mól) acetont és 12,8 g 2-(2,2-dimetil-propanoil)-oxiránt elkeverünk 50 ml szén-tetrakloriddal, és –35 °C hőmérsékleten keverés közben hozzá-csepegtetünk 5,2 g (0,02 mól) ón-tetrakloridot, a kapott keveréket az adagolás befejezése után még ezen a hőmérsékleten 3 órán át keverjük, majd hagyjuk 0 °C hőmérsékletre melegezni, és ekkor jégűtés közben 50 ml vizet adagolunk hozzá. A szerves fázist elválasztjuk, vízzel mossuk, nátrium-szulfáton szárítjuk, vákuumban betöményítjük és a visszamaradó anyagot desztilláljuk. Ily módon 8,6 g (46%) 4-(2,2-dimetil-propanoil)-2,2-dimetil-1,3-dioxolánt nyerünk.

MS (m/e -186, 171, 141, 129, 101, 57).

V-1 példa

(I/4 képletű vegyület)

67,3 g (0,5 mól) terc-butil-klór-metil-ke-ton (Bull. Soc. Chim. Fr. 1970, 3641–3646) és 42,9 g (0,5 mól) 35%-os vizes formaldehidoldatot elkeverünk 400 ml metanollal, szobahőmérsékleten hozzá-csepegtetünk 44,4 g (0,5 mól) 45%-os vizes nátrium-hidroxidot, és az adagolás befejezése után 2 órán át visszafolyatás mellett melegítjük, miközben a pH-értékét további nátrium-hidroxid adagolásával konstans értéken tartjuk (pH = 14). A reakciókeveréket ezután vizes sósavval semlegesítjük, a metanolt vákuumban ledesztilláljuk, a visszamaradó anyagot diklór-metánnal extraháljuk és nátrium-szulfáton szárítjuk, majd desztilláljuk. Ily módon 31,5 g (49%) 2-(2,2-Dimetil-propanoil)-oxiránt nyerünk. Fp.: 72–75 °C/20 mbar.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /tetrametil-szilán): δ = 1,27 (s, 9H), 3,86 (m, 1H) ppm.

A fentiekhez hasonlóan eljárva a következő táblázatban összefoglalt (I) általános képletnek megfelelő vegyületeket állítjuk elő.

Példa száma	R ¹	(a) képletű csoport	A	Fizikai adatok
2.	(CH ₃) ₃ C-	(a') képletű csoport	N	¹ H-NMR*): 1,02; 7,98; 8,15
3.	(1) képletű csoport	(a') képletű csoport	N	Op.: 65°C
4.	(2) képletű csoport	(a') képletű csoport	N	Op.: 175°C
5.	(3) képletű csoport	(a') képletű csoport	N	¹ H-NMR*): 8,02; 8,21
6.	(4) képletű csoport	(a') képletű csoport	N	¹ H-NMR*): 4,77
7.	(5) képletű csoport	(a') képletű csoport	N	¹ H-NMR*): 0,89; 0,895
8.	(6) képletű csoport	(a') képletű csoport	N	¹ H-NMR*): 4,72; 4,91; 1,00 (A diasztereomer)
9.	(6) képletű csoport	(a') képletű csoport	N	¹ H-NMR*): 0,9 (B diasztereomer)
10.	(7) képletű csoport	(a') képletű csoport	N	¹ H-NMR*): 0,95; 0,99
11.	(8) képletű csoport	(a') képletű csoport	N	n _D ²⁰ : 1,5346
12.	(9) képletű csoport	(a') képletű csoport	N	Op.: 102–104°C
13.	(10) képletű csoport	(a') képletű csoport	N	¹ H-NMR*): 1,26; 1,33

*) Az ¹H-NMR-spektrumot deuterokloroformban (CDCl₃ tetrametil-szilán (TMS) belső standard alkalmazásával vettük fel. A kémiai eltolás (δ) értékeket ppm-ben adjuk meg.

Biológiai példák

A következő biológiai példákban összehasonlító vegyületként a következő vegyületeket alkalmaztuk:

A képletű vegyület:

4-klór-fenil-5-pirimidil-metanol
(4417050. számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírás),

B képletű vegyület:

4-(4-klór-fenil)-3,3-dimetil-1-(1,2,4-triazol-1-il)-2-butanol (55833. számú európai szabadalmi leírás).

A példa

Venturia-teszt (alma) / Protektív

Oldószer: 4,7 tömegrész aceton

Emulgeátor: 0,3 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

A vizsgálathoz szükséges hatóanyag-készítmény előállításához (1) tömegrész hatóanyagot feloldunk a fentiekben megadott oldószerben az emulgeátor jelenlétében, majd a kapott koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A protektív hatás vizsgálatához a fiatal növényeket a fentiek szerint előállított készítménnyel cseppnedvesre permetezzük, majd megszáritjuk, és a növényeket vizes konódia szuszpenzióval (*Venturia inaequalis*) inokuláljuk, és a növényeket 1 napig (20) °C hőmérsékletű és 100% relatív nedvességtartalmú inkubációs székényben tartjuk.

A növényeket ezután növényházban 20 °C hőmérsékleten és 70% relatív nedvességtartalom mellett tartjuk.

A kiértékelést az inokulálást követő 12. napon végezzük.

A 3. és 4. példa szerint előállított vegyület 10 ppm koncentráció mellett igen kiváló hatást mutat, míg a B képletnek megfelelő vegyület közel hatástalan. A számszerű eredményeket az A/1 és A/2 táblázat tartalmazza.

B példa

Pyricularia-teszt (rizs) Protektív

Oldószer: 12,5 tömegrész aceton

Emulgeátor: 0,3 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

A vizsgálathoz szükséges készítmény előállításához 1 tömegrész hatóanyagot a fentiekben megadott oldószerben oldjuk az emulgeátor jelenlétében, majd a kapott koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A protektívhatás vizsgálatához a fiatal rizspalántákat a fentiek szerint nyert készítménnyel cseppnedvesre permetezzük, majd megszáradás után *Pyricularia oryzae* spóraszuszpenzióval inokuláljuk. Ezt követően a növényeket üvegházban 100% relatív nedvességtartalom mellett 25 °C hőmérsékleten tartjuk.

4 nappal az inokulálás után kiértékeljük a károsodást.

A 3. példa szerint előállított vegyület 0,025% koncentráció mellett igen kiváló hatást mutat, míg az A képletnek megfelelő ismert vegyület közel hatástalan. A számszerű eredményeket a B táblázat tartalmazza.

C példa

Erysiphe-teszt (árpa) / Protektív

Oldószer: 100 tömegrész dimetil-formamid

Emulgeátor: 0,25 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

A vizsgálathoz szükséges készítmény előállításához 1 tömegrész hatóanyagot a fentiekben megadott oldószerben oldunk az emulgeátor jelenlétében, majd a kapott koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A protektívhatás vizsgálatához a fiatal növényeket a fenti készítménnyel cseppnedvesre permetezzük, majd megszáritjuk, és a növényeket *Erysiphe graminis* f. sp. *hordei* spórával megfertőzzük.

A növényeket ezután üvegházban 20 °C hőmérsékleten 80% relatív nedvességtartalom mellett tartjuk, majd a károsodás mértékét 7 nappal az inokuláció után kiértékeljük.

A találmány szerinti 3., 5., 10. és 12. példa szerint előállított vegyületek 0,0025 tömeg% koncentrációnál 50–75%-kal magasabb hatást mutatnak, mint a B képletnek megfelelő ismert vegyület.

D példa

Cochliobolus sativus-teszt (árpa) / Protektív

Oldószer: 100 tömegrész dimetil-formamid

Emulgeátor: 0,25 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

A vizsgálathoz szükséges készítmény előállításához 1 tömegrész hatóanyagot feloldunk a fentiekben megadott oldószerben az emulgeátor jelenlétében, és a kapott koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A protektívhatás vizsgálatához a fiatal növényeket a fenti készítménnyel bepermetezzük, majd száradás után Cochliobolus sativus konídium szuszpenzióval beszórkjuk. A növényeket ezután 48 órán át 20 °C hőmérsékletű és 100% relatív nedvességtartalmú inkubációs szekrényben, majd ezt követően üvegházban 20 °C hőmérsékleten, és 80% relatív nedvességtartalom mellett tartjuk.

A kiértékelést 7 nappal az inokulálás után végezzük.

A 3., 5., 10. és 12. példák szerint előállított találmány szerinti vegyületek 0,025 tömeg% koncentrációban 63–75%-kal jobb hatást mutatnak, mint az ismert B képletnek megfelelő vegyület.

A számszerű eredményeket a D táblázat tartalmazza.

E példa

Pyrenophora teres-teszt (árpa) / Protektív

Oldószer: 100 tömegrész dimetil-formamid

Emulgeátor: 0,25 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

A vizsgálathoz szükséges hatóanyag-készítmény előállításához 1 tömegrész hatóanyagot feloldunk a fentiekben megadott oldószerben az emulgeátor jelenlétében, és a kapott koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A protektív hatás vizsgálatához a fiatal növényeket a fenti készítménnyel cseppnedvesre permetezzük, majd száradás után a növényeket Pyrenophora teres konídium szuszpenziójával beszórkjuk. A növényeket ezután (48) órán át 20 °C hőmérsékletű, és 100% relatív nedvességtartalmú inkubációs szekrényben, majd üvegházban 20 °C hőmérsékleten 80% relatív nedvességtartalom mellett tartjuk.

A kiértékelést 7 nappal az inokulálás után végezzük.

A 3., 5., 10. és 12. példák szerint előállított vegyületek például 0,025 tömeg% koncentráció esetében 46–55%-kal nagyobb hatást mutatnak, mint az ismert B általános képletű vegyület.

A számszerű eredményeket az E táblázat tartalmazza.

F példa

Fusarium culmorum-teszt (búza), vetőmagkezelés

A hatóanyagot száraz csávázószer formájában alkalmazzuk. Ezt úgy állítjuk elő, hogy a hatóanyagot őrölt természetes közetliszttel elkeverjük és homogenizáljuk. Az így nyert porkészítmény felvitelét úgy végezzük, hogy a fertőzött magokat zárt lombikban a porkészítménnyel 3 percig rázzuk.

2×100–100 magot 1 cm mélyen elültetünk és üvegházban 18 °C-on tartjuk, naponta 15 órás megvilágítás mellett. 3 héttel az ültetés után végezzük a kiértékelést.

5 A kapott eredményeket az F táblázat tartalmazza.

G példa

Leptosphaeria nodorum-teszt (búza) / Protektív

Oldószer: 100 tömegrész dimetil-formamid

10 Emulgeálószer: 0,25 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

A vizsgálathoz szükséges készítményt úgy állítjuk elő, hogy 1 tömegrész hatóanyagot a fenti komponensekkel elkeverünk és vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

15 A vizsgálathoz fiatal növényeket a fenti készítménnyel cseppnedvesre permetezzük, majd hagyjuk megszáradni és Leptosphaeria nodorum spóraszuszpenziójával bepermetezzük. Az így kezelt növényeket 20 °C-on 100% relatív nedvességtartalom mellett 48

20 órán át inkubáljuk, majd üvegházban 15 °C-on 80% relatív nedvességtartalom mellett tartjuk.

A kiértékelést az inokulálást követően 10 nappal végezzük.

A kapott eredményeket a G táblázat tartalmazza.

H példa

Venturia-teszt (alma) / Kuratív

Oldószer: 4,7 tömegrész acetone

Emulgeálószer: 0,3 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

30 A vizsgálathoz szükséges készítményt úgy állítjuk elő, hogy 1 tömegrész hatóanyagot a fenti komponensekkel elkeverünk és vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

35 A vizsgálathoz fiatal növényeket alma Venturia inaequalis vizes konídia szuszpenziójával inokuláljuk, majd a növényeket 20°-on 100% relatív nedvességtartalom mellett 1 napig inkubáljuk, majd üvegházban tartjuk néhány óráig és a vizsgálandó hatóanyagot tartalmazó készítménnyel cseppnedvesre

40 permetezzük.

A kiértékelést 12 nap után végezzük.

A kapott eredményeket a H táblázat tartalmazza.

I példa

Sphaerotheca-teszt (uborka) / Protektív

Oldószer: 4,7 tömegrész acetone

Emulgeálószer: 0,3 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

50 A vizsgálathoz szükséges készítmény előállításához 1 tömegrész hatóanyagot elkeverünk a fenti komponensekkel és a kapott koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A vizsgálathoz fiatal növényeket cseppnedvesre permetezzük a fenti készítménnyel, majd száradás után Sphaerotheca fuliginea konidiájával beporozzuk.

Az így kezelt növényeket üvegházban 75% relatív nedvességtartalom mellett 23–24 °C-on tartjuk.

A kiértékelést 10 nappal az inokulálást követően végezzük.

60 A kapott eredményeket az I. táblázat tartalmazza.

A/1 táblázat

Hatóanyag	Aktivitás %-ban 10 ppm hatóanyag-koncentráció esetén
B vegyület (összehasonlító)	0
3. példa	100
4. péla	94

A/2 táblázat

Hatóanyag	Fertőzés %-ban	
	10 ppm	1 ppm
	hatóanyag-koncentráció mellett	
B vegyület	64	
5. példa		0
10. példa		13
7. példa		13
12. példa		0

B táblázat

Hatóanyag	Hatóanyag-koncentráció a permetlében t%	Aktivitás %-ban a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva
B vegyület	0,025	0
3. példa	0,025	80
5. példa	0,025	90
10. példa	0,025	90
12. példa	0,025	80

C táblázat

Hatóanyag	Aktivitás %-ban a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva 25 ppm koncentrációnál
B vegyület	25
7. példa	100
6. példa	88
8. példa	75
11. példa	100
3. példa	100
5. példa	120
10. példa	88
12. példa	75

D táblázat

Hatóanyag	Aktivitás %-ban a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva 250 ppm koncentrációnál
B vegyület	25
7. példa	83
6. példa	83

Hatóanyag	Aktivitás %-ban a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva 250 ppm koncentrációnál
11. példa	100
1. példa	88
3. példa	100
5. példa	100
10. példa	88
12. példa	96

E táblázat

Hatóanyag	Aktivitás %-ban a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva 250 ppm koncentrációnál
B vegyület	45
7. példa	100
6. példa	90
4. példa	100
3. példa	100
5. példa	100
10. példa	91
12. példa	100

F táblázat

Hatóanyag	Hatóanyag-koncentráció a csávázószerben (mg/kg)	Aktivitás %-a a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva
C képletű vegyület (l. 4639 462 számú amerikai egysült államokbeli szabadalmi leírás)	500	58
3. példa	500	100

G táblázat

Hatóanyag	Hatóanyagkonc. a permetlében	Aktivitás %-a a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva
D képletű vegyület	250	36
E képletű vegyület (l. 4639 462 számú amerikai egysült államokbeli szabadalmi leírás)	250	50
3. példa	250	100

H táblázat

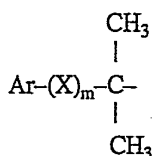
Hatóanyag	Aktivitás %-a a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva 1 ppm koncentrációnál
E vegyület	61
3. példa	100

I táblázat

Hatóanyag	Aktivitás %-a a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva 1 ppm koncentrációnál
E vegyület	0
3. példa	75

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Fungicid készítmény, *azzal jellemezve*, hogy 0,1–95 tömeg% mennyiségben valamely (I) általános képletű dioxolánszármazékot vagy annak savaddíciós sóját vagy fémsókomplexét tartalmazza – a képletben R^1 jelentése 1–8 szénatomos alkil-, 3–8 szénatomos cikloalkil-(1–8 szénatomos alkil)-, halogénatommal szubsztituált fenil vagy



általános képletű csoport, amelyben

Ar jelentése adott esetben halogénatommal, 1–4 szénatomos alkil- vagy halogén-1–4 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált fenilcsoport, X jelentése $-\text{CH}_2$ -csoport, vagy oxigénatom m jelentése 1,

A jelentése nitrogénatom és

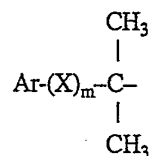
R^2 – R^6 mindegyikének jelentése hidrogénatom, és

R^5 és R^6 jelentése lehet még 1–4 szénatomos alkilcsoport is – szilárd hordozóanyaggal, előnyösen természetes közetlisztekkel vagy folyékony hordozó-

anyaggal, előnyösen szerves vagy szervetlen oldószerrel és/vagy egyéb segédanyaggal, előnyösen enmionos vagy anionos felületaktív anyaggal elkeverve.

5 2. Eljárás (I) általános képletű vegyületek, valamint savaddíciós sóik vagy fémsókomplexeik előállítására, amely képletben

R^1 jelentése 1–8 szénatomos alkil-, 3–8 szénatomos cikloalkil-(1–8 szénatomos alkil)-, halogénatommal szubsztituált fenil vagy



általános képletű csoport, amelyben

Ar jelentése adott esetben halogénatommal, 1–4 szénatomos alkil- vagy halogén-1–4 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált fenilcsoport,

X jelentése $-\text{CH}_2$ -csoport, vagy oxigénatom m jelentése 1,

25 A jelentése nitrogénatom és

R^2 – R^6 mindegyikének jelentése hidrogénatom, és

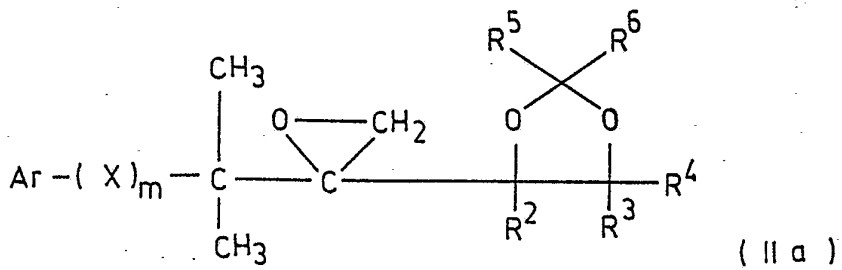
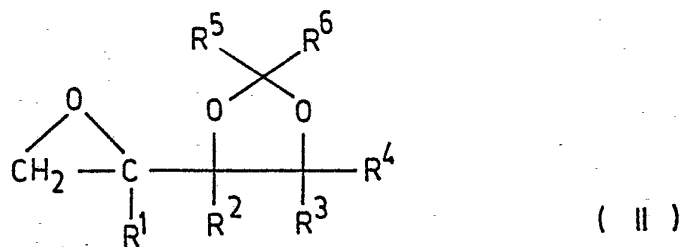
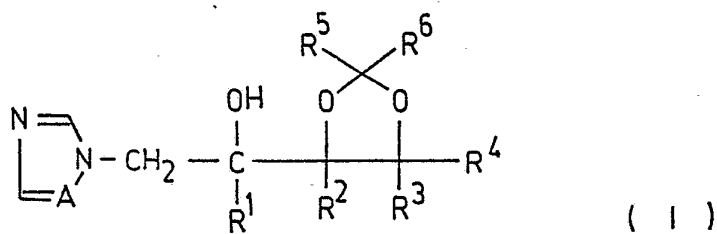
R^5 és R^6 jelentése lehet még 1–4 szénatomos alkilcsoport is –

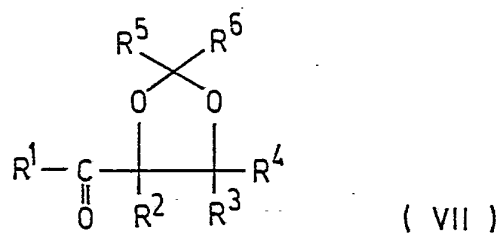
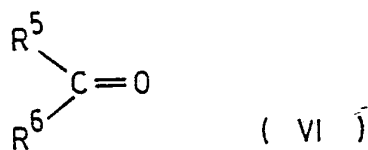
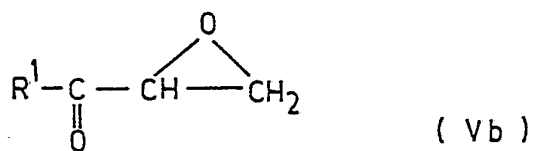
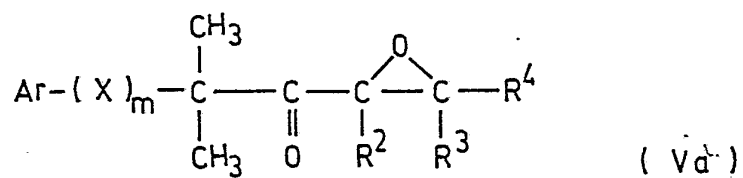
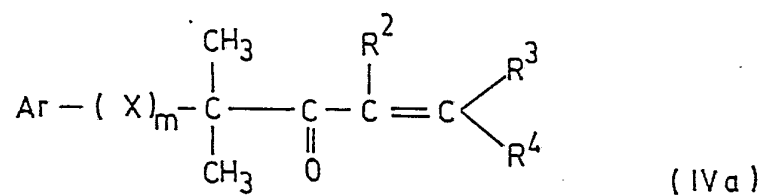
azzal jellemezve, hogy egy (II) általános képletű oxiranyl-dioxolánt – a képletben

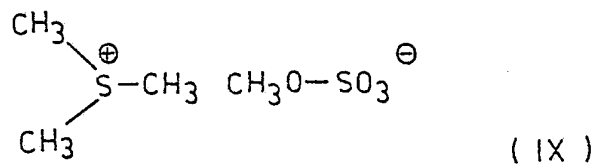
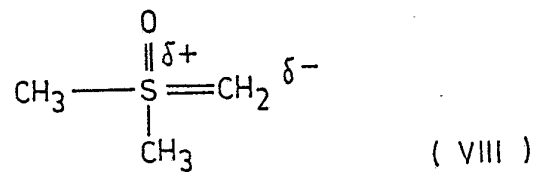
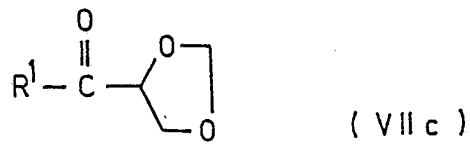
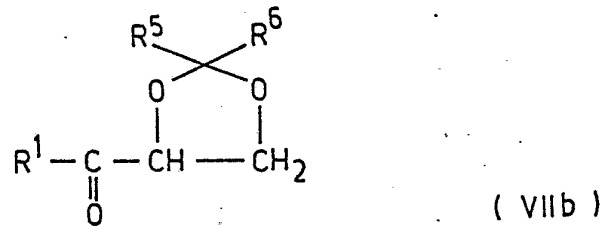
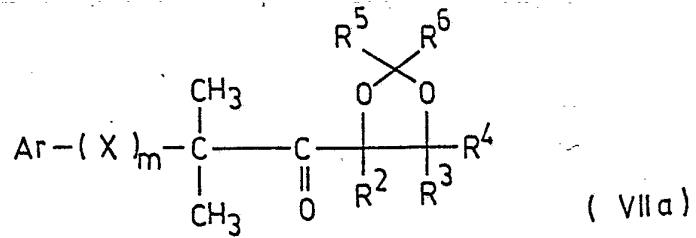
R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 és R^6 jelentése a fenti –

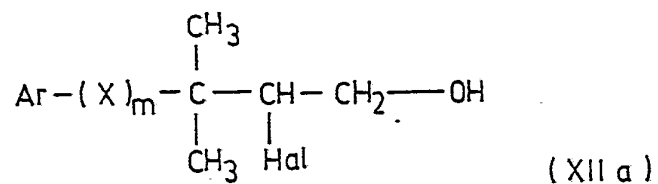
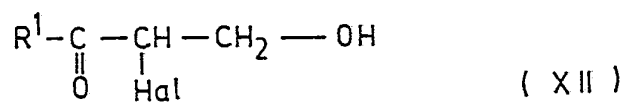
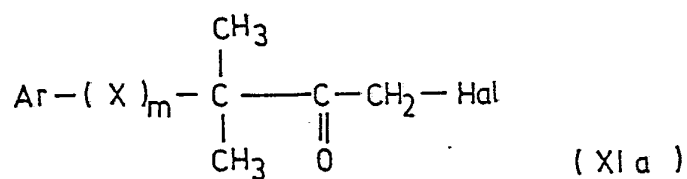
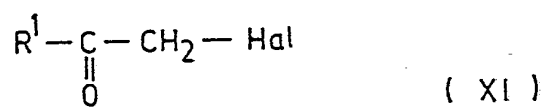
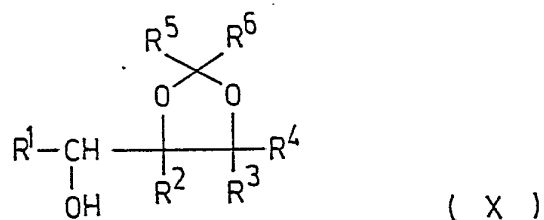
egy (III) általános képletű azollal – a képletben A jelentése a fenti – reagáltatunk, adott esetben hígítószer

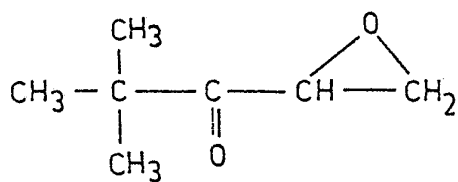
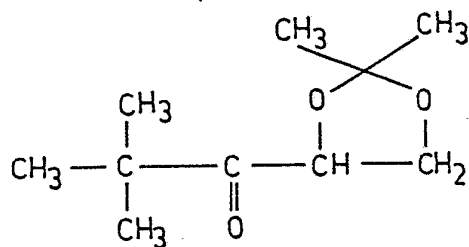
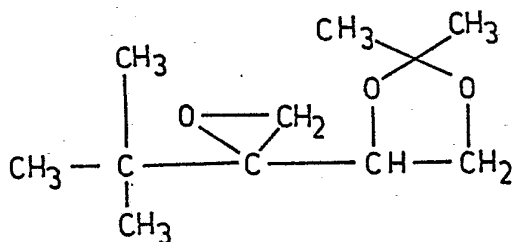
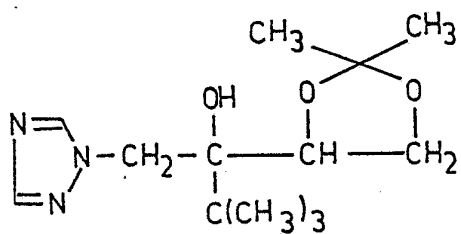
35 és adott esetben reakciólefutást elősegítő szer jelenlétében, majd kívánt esetben a kapott vegyületet savaddíciós sóvá vagy fémsókomplekszé alakítjuk.











A) reakcióvázlat

