



SCHWEIZERISCHE EIDGENOSSENSCHAFT
BUNDESAMT FÜR GEISTIGES EIGENTUM

⑤① Int. Cl.³: C 07 C 103/375
A 01 N 37/22

Erfindungspatent für die Schweiz und Liechtenstein

Schweizerisch-liechtensteinischer Patentschutzvertrag vom 22. Dezember 1978



⑫ PATENTSCHRIFT A5

⑪

635 819

②① Gesuchsnummer: 6076/78

⑦③ Inhaber:
CIBA-GEIGY AG, Basel

②② Anmeldungsdatum: 02.06.1978

②④ Patent erteilt: 29.04.1983

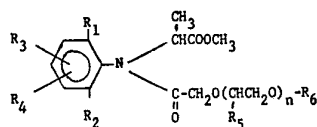
④⑤ Patentschrift
veröffentlicht: 29.04.1983

⑦② Erfinder:
Dr. Wolfgang Eckhardt, Lörrach (DE)
Dr. Adolf Hubele, Magden
Dr. Walter Kunz, Oberwil BL

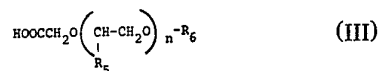
⑤④ Alkoxy-alkoxy-acetyl acylalanine, deren Herstellung und Verwendung als Pflanzenfungizide.

⑤⑦ Die neuen Verbindungen der Formel I

mit einer Verbindung der Formel III



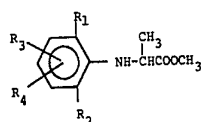
I



(III)

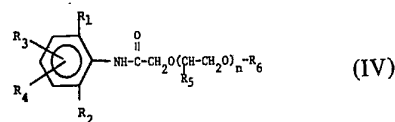
worin

R₁ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder Halogen,
R₂ C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder Halogen,
R₃ Wasserstoff, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder Halogen,
R₄ Wasserstoff oder Methyl,
R₅ Wasserstoff oder Methyl, und
R₆ C₁-C₄-Alkyl oder Phenyl bedeuten
während n für 1, 2 oder 3 steht, sind als Pestizide, vor allem Fungizide wirksam. Sie werden dadurch hergestellt, dass man entweder eine Verbindung der Formel II



(II)

oder einem ihrer reaktionsfähigen funktionellen Derivate acyliert, oder dass man eine acylierte Verbindung der Formel IV



(IV)

mit einer Verbindung der Formel V

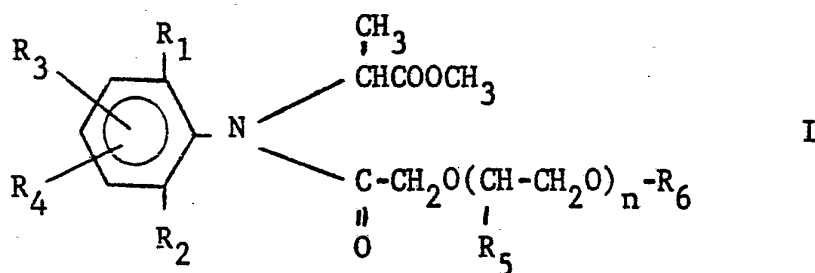


(V)

in Gegenwart eines Protonenakzeptors umgesetzt, wobei die Substituenten wie oben definiert sind.

PATENTANSPRÜCHE

1. Verbindungen der Formel I

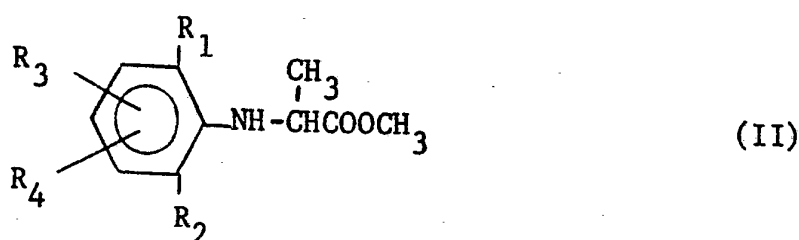


worin

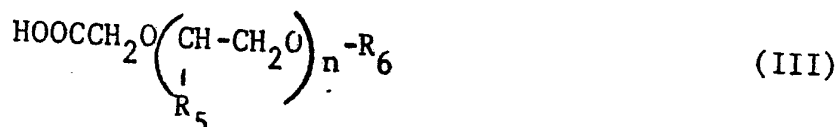
R₁ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder Halogen,
 R₂ C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder Halogen,
 R₃ Wasserstoff C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder Halogen,
 R₄ Wasserstoff oder Methyl,

R₅ Wasserstoff oder Methyl und
 R₆ C₁-C₄-Alkyl oder Phenyl bedeuten, während n für 1, 2 oder 3 steht.

2. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, gemäss Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel II



mit einer Säure der Formel III

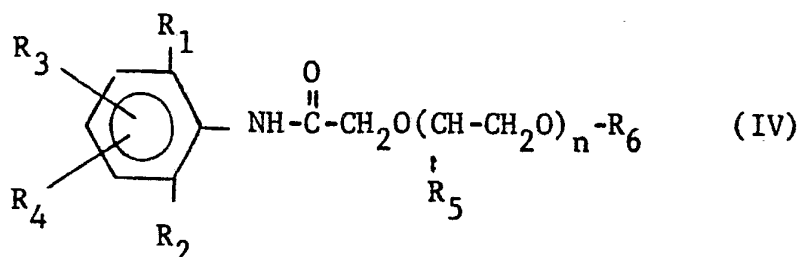


oder einer ihrer reaktionsfähigen funktionellen Säurederivate acyliert, wobei in den Formeln II und III die Substituenten R₁ bis R₆ die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben.

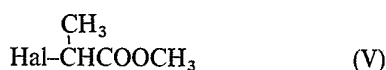
3. Verfahren nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet,

40 dass man als reaktionsfähiges funktionelles Säurederivat der Säure III deren Säurehalogenid oder Säureanhydrid einsetzt.

4. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, gemäss Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man eine acylierte Verbindung der Formel IV



mit einer Verbindung der Formel V



in Gegenwart eines Protonenakzeptors umgesetzt, wobei in den Formeln IV und V R₁ bis R₆ und n die für Formel I angegebene Bedeutungen haben, während Hal für Halogen steht.

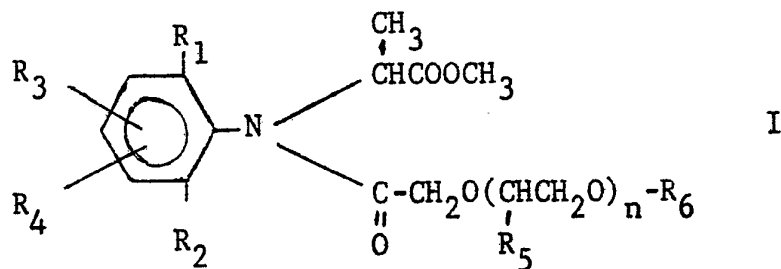
5. Verfahren nach Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, dass man als Protonenakzeptor Butyl-Lithium oder Na-Hydrid einsetzt.

60 6. Verfahren nach einem der Ansprüche 4 oder 5, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel V einsetzt, worin Hal für Chlor oder Brom steht.

7. Pflanzenschutzmittel enthaltend als aktive Komponente eine Verbindung der Formel I gemäss Anspruch 1.

65 8. Verwendung einer Verbindung der Formel I gemäss Anspruch 1 zur Bekämpfung von phytopathogenen Pilzen.

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Verbindungen der Formel I



worin

R₁ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder Halogen,
R₂ C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder Halogen,
R₃ Wasserstoff, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder Halo-

gen,

R₄ Wasserstoff oder Methyl,

R₅ Wasserstoff oder Methyl, und

R₆ C₁-C₄-Alkyl oder Phenyl bedeuten, während n für 1, 2 oder 3 steht.

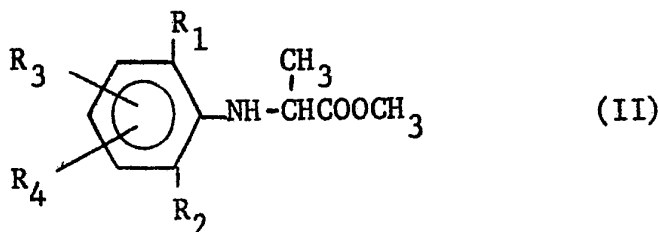
Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen sowie pflanzenfungizide Mittel, die diese Verbindungen als Wirk-

stoff enthalten, und die Verwendung dieser Wirkstoffe zur Bekämpfung von phytopathogenen Pilzen.

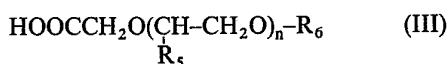
Unter Alkyl oder als Alkyl-Teil einer Alkoxy-Gruppe sind je nach Zahl der angegebenen Kohlenstoffatome folgende Gruppen zu verstehen: Methyl, Äthyl, Propyl, Isopropyl, Butyl, Isobutyl, sec. Butyl oder tert. Butyl.

Unter Halogen ist Fluor, Chlor, Brom oder Jod zu verstehen. Die Verbindungen der Formel I können hergestellt werden indem man,

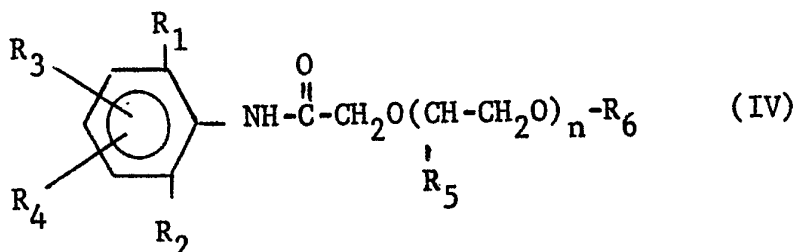
a) eine Verbindung der Formel II



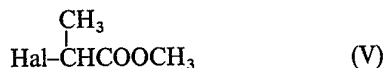
mit einer Verbindung der Formel III



oder mit einem reaktionsfähigen funktionellen Derivat derselben wie dem Säurehalogenid oder Anhydrid acyliert, oder b) eine acylierte Verbindung der Formel IV



mit einer Verbindung der Formel V



in Gegenwart eines Protonenakzeptors wie Butyl-Lithium oder Na-Hydrid umgesetzt, wobei in den Formeln II bis V R₁ bis R₆ und n die für Formel I angegebene Bedeutungen haben, während Hal für Halogen, vorzugsweise Chlor oder Brom steht.

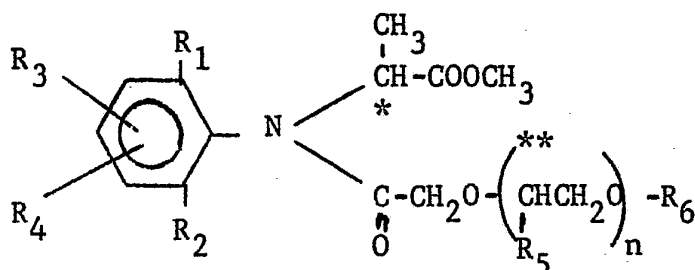
Die Umsetzungen können in An- oder Abwesenheit von gegenüber den Reaktionsteilnehmern inerten Lösungs- oder Verdünnungsmitteln durchgeführt werden. Es kommen beispielsweise folgende in Frage: aliphatische oder aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, Xylole, Petroläther; halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Chlorbenzol, Methylchlorid, Äthylchlorid, Chloroform; Äther und ätherar-

tige Verbindungen wie Dialkyläther, Dioxan, Tetrahydrofuran; Nitrile wie Acetonitril; N,N-dialkylierte Amide wie Dimethylformamid; Dimethylsulfoxid, Ketone wie Methyläthylketon und Gemische solcher Lösungsmittel untereinander.

Zur Acylierung gemäss Verfahren A lassen sich die entsprechenden Carbonsäuren selbst sowie z. B. ihre Ester, vorteilhaft jedoch die Säureanhydride oder die Säurehalogenide, bevorzugt die Säurechloride oder Säurebromide, einsetzen.

Die Reaktionstemperaturen liegen zwischen 0 und 180 °C, vorzugsweise zwischen 20 und 150 °C. In manchen Fällen ist die Verwendung von säurebindenden Mitteln bzw. Kondensationsmitteln vorteilhaft. Als solche kommen tertiäre Amine wie Trialkylamine (z. B. Triäthylamin), Pyridin und Pyridinbasen oder anorganische Basen, wie die Oxide und Hydroxide, Hydrogencarbonate und Carbonate von Alkali- und Erdalkalimetallen sowie Natriumacetat in Betracht.

Das von Verbindungen der Formel II ausgehende Herstellungsverfahren A kann auch ohne säurebindende Mittel durchgeführt werden, wobei in einigen Fällen das Durchleiten von Stickstoff zur Vertreibung des gebildeten Halogenwasserstoffs angezeigt ist. In anderen Fällen ist ein Zusatz von Dimethylformamid als Reaktionskatalysator sehr vorteilhaft.



Die Verbindungen der Formel II bis V werden analog zu an sich bekannten Methoden hergestellt.

Die Verbindungen der Formel I sowie die entsprechenden Ausgangsstoffe der Formeln II bis V besitzen 1 oder 2 Asymmetriezentren (* bzw. **, wenn $R_5 = \text{CH}_3$)

und können auf übliche Art (z. B. fraktionierte Kristallisation oder chromatographische Trennung) in optische Antipoden gespalten werden. Die verschiedenen Konfigurationen der Formel I besitzen unterschiedlich starke mikrobizide Wirkung. Der Einfluss weiterer möglicher Asymmetriezentren im Molekül und die Atropisomerie und die Phenyl-N-Achse sind auf die mikrobizide Wirksamkeit des Gesamtmoleküls von geringem Einfluss. Sofern keine gezielte Synthese zur Isolierung reiner Isomere der Formel I oder ihrer eingesetzten Vorprodukte durchgeführt wird, fällt normalerweise ein Produkt als Isomerengemisch an. Falls nicht anders vermerkt, ist im folgenden bei der Nennung der Verbindungen immer ein Gemisch der verschiedenen Isomere gemeint. Die Verbindungen der Formel I weisen ein für die praktischen Bedürfnisse sehr günstiges Mikrobizid-Spektrum zum Schutze von Kulturpflanzen auf ohne diese durch unerwünschte Nebenwirkungen nachteilig zu beeinflussen. Kulturpflanzen seien im Rahmen vorliegender Erfindung, beispielsweise Getreide, Mais, Reis, Gemüse, Zuckerrüben, Soja, Erdnüsse, Obstbäume, Zierpflanzen, vor allem aber Reben, Hopfen, Gürkengewächse (Gurken, Kürbis, Melonen), Solanaceen wie Kartoffeln, Tabak und Tomaten sowie auch Bananen-, Kakao- und Naturkautschuk-Gewächse.

Mit den Wirkstoffen der Formel I können an Pflanzen oder Pflanzenteilen (Früchte, Blüten, Laubwerk, Stengel, Knollen, Wurzeln) dieser und verwandter Nutzkulturen die auftretenden Pilze eingedämmt oder vernichtet werden, wobei auch später zuwachsende Pflanzenteile von derartigen Pilzen verschont bleiben. Die Wirkstoffe sind gegen die den folgenden Klassen angehörenden phytopathogenen Pilze wirksam: Ascomycetes (z. B. Erysiphaceae); Basidiomycetes, wie vor allem Rostpilze; Fungi imperfecti (z. B. Moniliales); dann aber besonders gegen die der Klasse der Phycomycetes angehörenden Oomycetes wie Phytophthora, Peronospora, Pseudoperonospora, Pythium oder Plasmopara. Überdies wirken die Verbindungen der Formel I systemisch. Sie können ferner als Beizmittel zur Behandlung von Saatgut (Früchte, Knollen, Körner) und Pflanzenstecklingen zum Schutz vor Pilzinfektionen sowie gegen im Erdboden auftretende phytopathogene Pilze eingesetzt werden.

Als Pflanzenfungizide bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, bei denen R_1 Methyl, R_2 Methyl, Äthyl, Chlor oder Brom, R_3 Wasserstoff, Halogen oder Methyl und R_4 Wasserstoff oder Methyl bedeuten, während R_5 , R_6 und n die für Formel I angegebenen Bedeutungen haben.

Als R_5 wird Wasserstoff bevorzugt.

25 Eine interessante Gruppe von Verbindungen ist diejenige, worin in der Formel I R_6 für Methyl steht. n steht vorzugsweise für 1.

Auch Kombinationen dieser Gruppen untereinander sind als bevorzugt zu verstehen.

30 Durch sehr hohe Wirksamkeit zeichnet sich unter anderen die im folgenden als Nr. 2 aufgeführte Verbindung aus. Sie ist damit im Rahmen vorliegender Erfindung eine bevorzugte Einzelverbindung.

Die Verbindungen der Formel I können für sich allein 35 oder zusammen mit geeigneten Trägern und/oder anderen Zuschlagstoffen verwendet werden. Geeignete Träger und Zuschlagstoffe können fest oder flüssig sein und entsprechen den in der Formulierungstechnik üblichen Stoffen wie z. B. natürlichen oder regenerierten mineralischen Stoffen, Lösungsmitteln, Dispergier-, Netz-, Haft-, Verdickungs-, Binde- oder Düngemitteln.

Der Gehalt an Wirkstoff in handelsfähigen Mitteln liegt zwischen 0,1 bis 90%.

Zur Applikation können die Verbindungen der Formel I 45 in den folgenden Aufarbeitungsformen vorliegen (wobei die Gewichts-Prozentangaben in Klammern vorteilhafte Mengen an Wirkstoff darstellen):

50 Feste Aufarbeitungsformen: Stäubemittel und Streumittel (bis zu 10%) Granulate, Umhüllungsgranulate, Imprägnierungsgranulate und Homogengranulate, Pellets (Körner) (1 bis 80%):

Flüssige Aufarbeitungsformen:

55 a) in Wasser dispergierbare Wirkstoffkonzentrate: Spritzpulver (wetable powders) und Pasten (25 bis 90% in der Handelspackung, 0,01 bis 15% in gebrauchsfertiger Lösung); Emulsions- und Lösungskonzentrate (10 bis 50%; 0,01 bis 15% in gebrauchsfertiger Lösung);

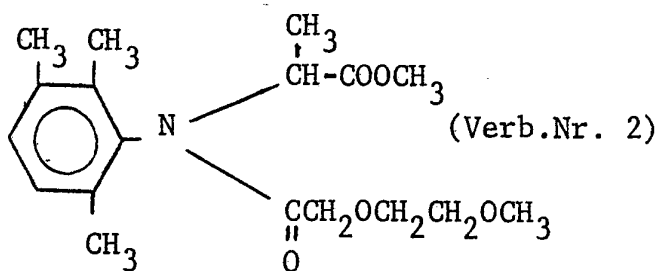
Lösungen (0,1 bis 20%); Aerosole

60 Die Verbindungen der Formel I können zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums auch mit weiteren bekannten Fungiziden sowie auch mit geeigneten Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Herbiziden, Düngemitteln usw. kombiniert werden.

65 Die nachfolgenden Beispiele dienen der näheren Erläuterung der Erfindung ohne dieselbe einzuschränken. Die Temperaturangaben beziehen sich auf Celsius-Grade.

Herstellungsbeispiel
Beispiel 1

Herstellung von



N-(1'-Methoxycarbonyl-ethyl)-N-(2'-methoxy-äthoxyacetyl)-2,3,6-trimethylanilin

11,1 g (0,05 Mol) N-(1'-Methoxycarbonyl-ethyl)-2,3,6-trimethylanilin werden in 80 ml Toluol gelöst und bei Raumtemperatur tropfenweise mit einer Lösung von 15,2 g (0,1 Mol) 2'-Methoxyäthoxy-acetylchlorid in 20 ml Toluol versetzt. Dann wird das Reaktionsgemisch 16 Std. am Rückfluss gekocht und das entstehende HCl-Gas mit Stickstoff ausgetrieben. Nach dem Abkühlen

wird die Toluollösung nacheinander mit 1n Natronlauge und Wasser gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet, filtriert und am Wasserstrahlrahmen eingedampft. Das zurückbleibende Öl ergibt 8,9 g Produkt von Sdp. 154–160 °C bei 0,1 Torr.

Auf analoge Weise oder nach einer der hierin beschriebenen Methoden können folgende Verbindungen hergestellt werden:

Tabelle I
(R₅ = H)

Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	n	R ₆	Physikalische Daten
1	CH ₃	CH ₃	H	H	1	CH ₃	Sdp. 152–155 °C/0,15 Torr
2	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	H	1	CH ₃	Sdp. 154–160 °C/0,1 Torr
3	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃	1	CH ₃	Sdp. 155–158 °C/0,1 Torr
4	CH ₃	Cl	H	H	1	CH ₃	Sdp. 160–168 °C/0,15 Torr
5	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	1	CH ₃	Sdp. 161–166 °C/0,2 Torr
6	CH ₃	CH ₃	4-Br	H	1	CH ₃	Sdp. 178–183 °C/0,2 Torr
7	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	1	CH ₃	
8	CH ₃	OCH ₃	H	H	1	CH ₃	
9	CH ₃	CH ₃	H	H	1	C ₂ H ₅	
10	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	H	1	C ₂ H ₅	
11	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃	1	C ₂ H ₅	
12	CH ₃	CH ₃	H	H	1	C ₄ H ₉ (n)	
13	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	1	C ₄ H ₉ (n)	
14	CH ₃	CH ₃	H	H	2	CH ₃	n _D ²¹ 1,5130
15	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	H	2	CH ₃	n _D ²¹ 1,5170
16	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃	2	CH ₃	Öl
17	CH ₃	CH ₃	H	H	2	C ₂ H ₅	
18	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	H	2	C ₂ H ₅	
19	CH ₃	CH ₃	H	H	3	C ₂ H ₅	
20	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃	3	C ₂ H ₅	
21	CH ₃	CH ₃	H	H	3	C ₄ H ₉ (n)	
22	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	3	C ₄ H ₉ (n)	
23	CH ₃	CH ₃	H	H	1	C ₆ H ₅ -	
24	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	H	1	C ₆ H ₅ -	
25	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃	1	C ₆ H ₅ -	
26	CH ₃	CH ₃	H	H	2	C ₄ H ₉ (n)	n _D ²¹ 1,6898

Tabelle II
(R₅ = CH₃; R₆ = CH₃, n = 1)

Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
27	CH ₃	CH ₃	H	H
28	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	H
29	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃
30	CH ₃	Cl	H	H
31	CH ₃	OCH ₃	H	H
32	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H
33	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H

Biologische Beispiele
Beispiel 2

Wirkung gegen *Pythium debaryanum* an Zuckerrüben

Der Pilz wurde auf sterilen Haferkörnern kultiviert und einer Erde-Sand-Mischung beigegeben. Die so infizierte Erde wurde in Blumentöpfe abgefüllt und mit Zuckerrübensamen besät. Gleich nach der Aussaat wurden die als Spritzpulver formulierten Versuchspräparate als wässrige Suspensionen über die Erde gegossen (20 ppm Wirkstoff bezogen auf das Erdvolumen).

Die Töpfe wurden darauf während 2–3 Wochen im Gewächshaus bei 20 bis 24 °C aufgestellt. Die Erde wur-

de dabei durch leichtes Besprühen mit Wasser gleichmässig feucht gehalten. Bei der Auswertung der Tests wurde der Auflauf der Zuckerrübenpflanzen sowie der Anteil gesunder und kranker.

Beispiel 3

Wirkung gegen *Phytophthora infestans* auf Tomaten

a) Kurative Wirkung

Tomatenpflanzen der Sorte «Roter Gnom» wurden nach dreiwöchiger Anzucht mit einer Zoosporensuspension des Pilzes besprüht und in einer Kabine bei 18 bis 20°C und gesättigter Luftfeuchtigkeit inkubiert. Unterbruch der Befeuchtung nach 24 Stunden. Nach dem Abtrocknen der Pflanzen wurden diese mit einer Brühe besprüht, die die als Spritzpulver formulierte Wirksubstanz in einer Konzentration von 0,06% enthält. Nach dem Abtrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen wieder in der Feuchtkabine während 4 Tagen aufgestellt. Anzahl und Grösse der nach dieser Zeit auftretenden typischen Blattflecken waren der Bewertungsmaßstab für die Wirksamkeit der geprüften Substanzen.

b) Präventiv-Systemische Wirkung

Die als Spritzpulver formulierte Wirksubstanz wurde in einer Konzentration von 0,006% (bezogen auf das Bodenvolumen) auf die Bodenoberfläche von drei Wochen alten eingetopften Tomatenpflanzen der Sorte «Roter Gnom» gegeben. Nach dreitägiger Wartezeit wurde die Blattunterseite der Pflanzen mit einer Zoosporensuspension von *Phytophthora infestans* besprüht. Sie wurden dann 5 Tage in einer Sprühkabine bei 18 bis 20°C und gesättigter Luftfeuchtigkeit gehalten. Nach dieser Zeit bildeten sich typische Blattflecken, deren Anzahl und Grösse zur Bewertung der Wirksamkeit der geprüften Substanzen dienten.

Beispiel 4

Wirkung gegen *Plasmopara viticola* (Bert. et Curt) (Berl. et DeToni) auf Reben

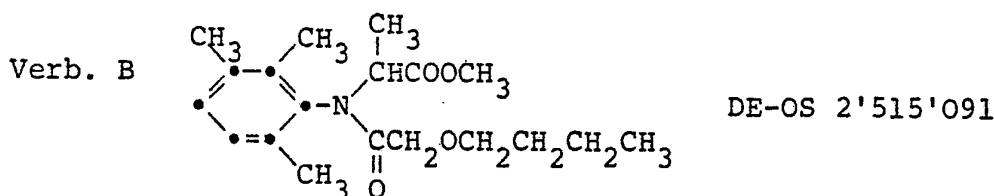
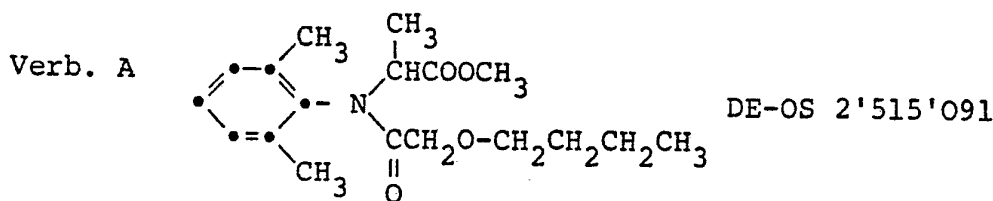
a) Residual-präventive Wirkung

Im Gewächshaus wurden Rebenstecklinge der Sorte «Chasselas» herangezogen. Im 10-Blatt-Stadium wurden 3 Pflanzen mit einer aus der als Spritzpulver formulierten Wirksubstanz hergestellten Brühe (0,06% Wirkstoff) besprüht. Nach dem Abtrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen auf der Blattunterseite mit der Sporensuspension des Pilzes gleichmässig infiziert. Die Pflanzen wurden anschliessend während 8 Tagen in einer Feuchtkammer gehalten. Nach dieser Zeit zeigten sich deutliche Krankheitssymptome an den Kontrollpflanzen. Anzahl und Grösse der Infektionsstellen an den behandelten Pflanzen dienten als Bewertungsmaßstab für die Wirksamkeit der geprüften Substanzen.

b) Kurative Wirkung

Rebenstecklinge der Sorte «Chasselas» wurden im Gewächshaus herangezogen und im 10-Blatt-Stadium mit einer Sporensuspension von *Plasmopara viticola* an der Blattunterseite infiziert. Nach 24 Std. Aufenthalt in der Feuchtkabine wurden die Pflanzen mit einer 0,06%igen Wirkstoffbrühe besprüht, die aus einem Spritzpulver des Wirkstoffs hergestellt worden war. Anschliessend wurden die Pflanzen 7 Tage weiterhin in der Feuchtkabine gehalten. Nach dieser Zeit zeigten sich die Krankheitssymptome an den Kontrollpflanzen. Anzahl und Grösse der Infektionsstellen an den behandelten Pflanzen dienten als Bewertungsmaßstab für die Wirksamkeit der geprüften Substanzen.

Bei den durchgeführten biologischen Versuchen (Beispiel 2, 3 und 4) wurden folgende strukturell nächstvergleichbaren Verbindungen des Standes der Technik zum Wirkungsvergleich herangezogen:



Ein Pilzbefall von über 50% kennzeichnet die betreffende Aktivsubstanz als für praktische Zwecke wirkungslos. (Es erfolgt deshalb keine weitere Differenzierung.)

Im einzelnen wurden folgende Resultate erzielt:

Zu Beispiel 2

Wirkung gegen *Pythium debaryanum* auf Zuckerrüben

Nach der Behandlung mit einem der Wirkstoffe Nr. 1, 2, 3, 4, 5, 6, 14, 15, 16 und 26 liefen unter den Testbedingungen mehr als 94% der Zuckerrübenpflanzen auf und hatten ein gesundes Aussehen. Nach Behandlung mit den Vergleichs-

substanzen A und B liefen unter den gleichen Testbedingungen 83 bis 86% der Zuckerrübenpflanzen auf. Bei der unbehandelten Kontrolle liefen weniger als 20% der Pflanzen mit zum Teil kränklichem Aussehen auf.

Zu Beispiel 3
Wirkung gegen *Phytophthora infestans* auf Tomaten
a) Kurative Wirkung
b) Präventiv systemische Wirkung

Geprüfte Verbindung Nr.	Prüfkonzentration [ppm]	Pilzbefall im Vergleich zu unbehandelten Kontrollpflanzen (= 100% Befall)
A	200	a) mehr als 50%
	200	b) 45–50%
	60	b) mehr als 50%
B	200	a) 45–50%
	60	a) mehr als 50%
	200	b) 5–20%
1	60	a) 0–5%
	60	b) 0–5%
2	60	a) 30–40%
	60	b) 0–5%
3	60	a) 25–35%
	60	b) 20–30%
4	60	a) 30–45%
	200	b) 20–35%
	60	b) 30–40%
5	200	a) 15–25%
	60	a) 30–40%
	60	b) 10–25%
6	200	a) 30–45%
	200	b) 20–40%
	60	b) über 50%
14	60	a) 25–35%
	60	b) 5–10%
15	200	a) 10–20%
	60	a) 25–35%
	200	b) 0–5%
16	60	b) 10–15%
	200	a) 35–45%
	60	a) über 50%
	200	b) über 50%

Zu Beispiel 4

Wirkung gegen *Plasmopara viticola* auf Reben (Versuch a und b)

In den Versuchen a) und b) zeigten Pflanzen, die mit Vergleichssubstanz A behandelt worden waren, einen Pilzbefall von 25 bis 40% und Pflanzen, die mit Substanz B behandelt worden waren, einen Befall von 30 bis 35%. Die Verbindungen Nr. 1, 2, 3, 4, 5, 6, 14, 15, 16 und 26 hemmten in beiden Versuchen den Befall auf weniger als 30%. Als Vergleich dienten unbehandelte aber infizierte Kontrollpflanzen (= 100% Befall).

Formulierungsbeispiele

Beispiel 5

Stäubemittel:

Zur Herstellung eines a) 5%igen und b) 2%igen Stäubemittels werden die folgenden Stoffe verwendet:

- a) 5 Teile Wirkstoff
- 95 Teile Talkum;
- b) 2 Teile Wirkstoff
- 1 Teil hochdisperse Kieselsäure,
- 97 Teile Talkum;

Die Wirkstoffe werden mit den Trägerstoffen vermischt und vermahlen und können in dieser Form zur Anwendung verstäubt werden.

Beispiel 6

Granulat:

Zur Herstellung eines 5%igen Granulats werden die folgenden Stoffe verwendet:

- 5 Teile Wirkstoff
- 0,25 Teile Epichlorhydrin,
- 0,25 Teile Cetylpolyglykoläther,
- 3,50 Teile Polyäthylenglykol
- 91 Teile Kaolin (Korngrösse 0,3–0,8 mm).

Die Aktivsubstanz wird mit Epichlorhydrin vermischt und mit 6 Teilen Aceton gelöst, hierauf wird Polyäthylenglykol und Cetylpolyglykoläther zugesetzt. Die so erhaltene Lösung wird auf Kaolin aufgesprüht, und anschliessend wird das Aceton im Vakuum verdampft. Ein derartiges Mikrogranulat wird vorteilhaft zur Bekämpfung von Bodenpilzen verwendet.

Beispiel 7

Spritzpulver:

Zur Herstellung eines a) 70%igen b) 40%igen c) und d) 25%igen e) 10%igen Spritzpulvers werden folgende Bestandteile verwendet:

- a) 70 Teile Wirkstoff
- 5 Teile Natriumdibutyl-naphthylsulfonat,
- 3 Teile Naphthalinsulfonsäuren-Phenolsulfonsäuren-Formaldehyd-Kondensat 3 : 2 : 1,
- 10 Teile Kaolin,
- 12 Teile Champagne-Kreide;
- b) 40 Teile Wirkstoff
- 5 Teile Ligninsulfonsäure-Natriumsalz,
- 1 Teil Dibutyl-naphthalinsulfonsäure-Natriumsalz,
- 54 Teile Kieselsäure;
- c) 25 Teile Wirkstoff
- 4,5 Teile Calcium-Ligninsulfonat,
- 1,9 Teile Champagne-Kreide/Hydroxyäthylcellulose-Gemisch (1 : 1),
- 1,5 Teile Natrium-dibutyl-naphthalinsulfonat,
- 19,5 Teile Kieselsäure,
- 19,5 Teile Champagne-Kreide,
- 28,1 Teile Kaolin;
- d) 25 Teile Wirkstoff
- 2,5 Teile Isooctylphenoxy-polyoxyäthyl-äthanol,
- 1,7 Teile Champagne-Kreide/Hydroxyäthylcellulose-Gemisch (1 : 1),
- 8,3 Teile Natriumaluminiumsilikat,
- 16,5 Teile Kieselgur,
- 46 Teile Kaolin;
- e) 10 Teile Wirkstoff
- 3 Teile Gemisch der Natriumsalze von gesättigten Fettalkoholsulfaten,
- 5 Teile Naphthalinsulfonsäure/Formaldehyd-Kondensat,
- 82 Teile Kaolin;

Die Wirkstoffe werden in geeigneten Mischern mit den Zuschlagstoffen innig vermischt und auf entsprechenden Mühlen und Walzen vermahlen. Man erhält Spritzpulver von vorzüglicher Benetzbarkeit und Schwebefähigkeit, die sich mit Wasser zu Suspensionen der gewünschten Konzen-

tration verdünnen und insbesondere zur Blattapplikation verwenden lassen.

Beispiel 8

Emulgierbare Konzentrate:

Zur Herstellung eines 25%igen emulgierbaren Konzentrates werden folgende Stoffe verwendet:

25 Teile Wirkstoff

2,5 Teile epoxydiertes Pflanzenöl,

10 Teile eines Alkylarylsulfonat/Fettalkoholpolyglykoläther-Gemisches,

5 Teile Dimethylformamid,

57,5 Teile Xylol.

Aus solchen Konzentraten können durch Verdünnen mit Wasser Emulsionen der gewünschten Konzentration hergestellt werden, die besonders zur Blattapplikation geeignet sind.