

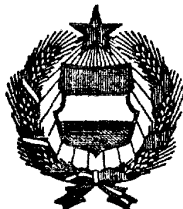
(19) HU

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) (13)

194 698 B

MAGYAR
NÉPKÖZTÁRSASÁG



ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL

(21) (867/85) (22) A bejelentés napja: 85. 03. 07.

A bejelentés elsőbbsége

(33) DE

(32) 84. 03. 08.

(31) (P 34 08 540.8)

Nemzetközi
osztályjelzet:

(51) Int. Cl. 4:

A 01 N 43/80

C 07 D 275/06

(41) (42) Közzététel napja: 85. 11. 28.

(45) A leírás megjelent: 88. 10. 31.



Feltaláló(k): (72)

Salzburg Herbert, Hajek Manfred, Köln, Hänssler Gerd, Leverkusen, DE

Szabadalmas: (73)

Bayer AG., Leverkusen, DE

(54) HATÓANYAGKÉNT 3-HIDRAZINO-BENZIZOTIAZOL-1,1-DIOXID-SZÁRMAZÉKOKAT
TARTALMAZÓ FUNGICID KÉSZÍTMÉNYEK ÉS ELJÁRÁS
3-(ALKIL-KRABAMOIL-HIDRAZINO-BENZIZOTIAZOL-1,1-DIOXID-SZÁRMAZÉKOK
ELŐÁLLÍTÁSÁRA

(57) KIVONAT

A találmány szerinti készítmények hatóanyagai-
nak (I) általános képletében

R¹ jelentése hidrogénatom,

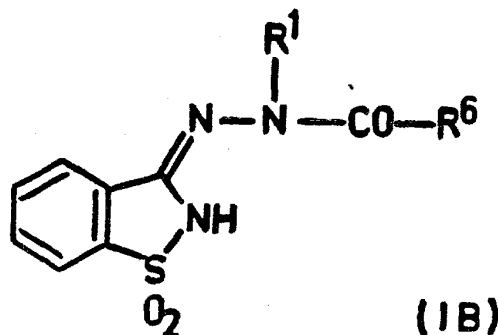
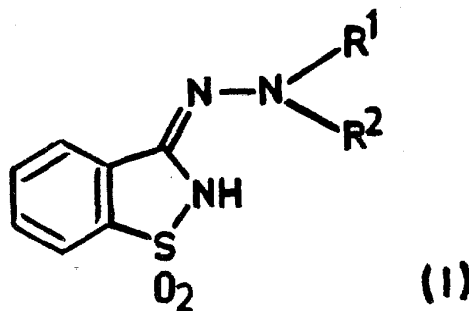
R² jelentése -CO-R³ csoport, amely képletben
R³ jelentése 1-4 szénatomos alkil-, (1-4 szén-
atomos alkil)-amino-, (5-6 szénatomos ciklo-
alkil)-aminofenil- vagy fenil-amino-csoport,
vagy

R¹ és R² jelentése együtt =CR⁴R⁵ csoport, amely-
ben

R⁴ jelentése hidrogénatom és

R⁵ jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport.

A találmány szerinti eljárással (I) általános képletű
vegyületek szűkebb körébe tartozó (IB) általános kép-
letű vegyületeket állítják elő.



A találmány túlnyomórészt ismert 3-hidrazino-benzizotiazol-1,1-dioxid-származékok fungicid szerként való felhasználásra vonatkozik. A 3-hidrazino-benzizotiazol-1,1-dioxid-származékok gyógyászati területen való felhasználása ismert [Whitehead és mtársai, J. Med. Chem. 10, 877. (1967)], fungicid hatása alapján való felhasználása azonban új.

A 3-(alkenil-oxi)-benzizotiazol-1,1-dioxidok, így például a 3-(allil-oxi)-benzizotiazol-1,1-dioxid szintén ismert vegyület, és ugyancsak ismert a növényvédelemben való felhasználása [7 014 301 számú japán szabadalom; CA 73: 43 500 m].

Azt találtuk, hogy az (I) általános képletű, gyógyhatású vegyületként ismert 3-hidrazino-benzizotiazol-1,1-dioxid-származékok jó fungicid hatásúak. Az (I) általános képletben

R¹ jelentése hidrogénatom,
 R² jelentése $-\text{CO}-\text{R}^3$ csoport, amely képletben
 R³ jelentése 1–4 szénatomos alkil-, (1–4 szénatomos alkil)-amino-, (5–6 szénatomos cikloalkil)-amino-, fenil- vagy fenil-amino-csoport, vagy
 R¹ és R² jelentése együtt $=\text{CR}^4\text{R}^5$ csoport, amelyben
 R⁴ jelentése hidrogénatom és
 R⁵ jelentése 1–4 szénatomos alkilcsoport.

Meglepetésre azt találtuk, hogy az (I) általános képletű 3-hidrazino-benzizotiazol-1,1-dioxid-származékok fungicid hatása, különösen szisztémikus hatása nagyobb, mint a technika állása szerint ismert, más hasonló vegyületeké. A 3-hidrazino-benzizotiazol-1,1-dioxid-származékok találmány szerinti új alkalmazása így a technika szakterület gazdagítását jelenti.

A találmány szerinti új készítményekben hatóanyagként alkalmazott 3-hidrazino-benzizotiazol-1,1-dioxid-származékokat az (I) általános képlettel írjuk le.

Az (I) általános képletű vegyületek az (A) sémával leírható egyensúlyban vannak az (IA) általános képletű vegyületekkel.

A következőkben az egyszerűség kedvéért mindig (I) általános képletű vegyületeket említünk, de ezek alatt minden esetben vagy a tiszta vegyületet, vagy az (I) és (IA) általános képletű vegyületeket különböző arányú keverékét értjük.

A találmány szerinti felhasználásra előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletben

R¹ jelentése hidrogénatom,
 R² jelentése $-\text{CO}-\text{R}^3$ csoport, amelyben
 R³ jelentése metil-, etil-, n- vagy izopropil-, fenil-, metil-amino-, etil-amino-, n- vagy izopropil-amino-, ciklohexil-amino- vagy fenil-amino-csoport, vagy
 R¹ és R² jelentése együtt $=\text{CR}^4\text{R}^5$ csoport, melyben
 R⁴ jelentése hidrogénatom,
 R⁵ jelentése metil-, etil-, n- vagy izopropil-csoport.

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

A találmány szerinti készítményeknél felhasznált (I) általános képletű vegyületek túlnyomórészt ismertek és ismert eljárások szerint előállíthatók [például: Whitehead és mtársai, J. Med. Chem., 10, 844–849 (1967), vagy J. Am. Chem. Soc., 65, 457–458 (1943)]. Így a 3-hidrazino-2H,3H-benzizotiazol-1,1-dioxidot aktív karbonsav-származékokkal, így például arhidridekkel vagy halogenidekkel reagáltatjuk a B reakcióvázlat szerint. A B reakcióvázlaton a képletekben R¹ jelentése a fenti, R^{3'} jelentése a fenti, kivéve az aminszármazékokat, és X jelentése halogénatom vagy $-\text{O}-\text{CO}-\text{R}^{3'}$ csoport.

A reakciót általában normál nyomáson, 0–100 °C közötti hőmérsékleten, adott esetben valamely bázis jelenlétében végezzük inert oldószerben. Oldószerként például dioxánt, kloroformot, metilén-kloridot vagy toluolt használhatunk.

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R¹ és R² együtt $=\text{CR}^4\text{R}^5$ csoport, szintén ismert eljárások szerint állíthatók elő. [Whitehead és mtársai, J. Med. Chem., 10, 844–849 (1967)]. A 3-hidrazino-benzizotiazol-1,1-dioxidot oxo-vegyülettel a C reakcióvázlat szerint reagáltatjuk. A C reakcióvázlaton szereplő vegyületekben R⁴ és R⁵ jelentése a fenti. A reakciónál a komponenseket általában sztöchiometrikus arányban reagáltatjuk, melegítés közben, alkalmas oldószerben, így például dioxánban, etanolban, dimetil-formamidban vagy toluolban. A reakciót általában normál nyomáson, 10–120 °C, előnyösen 80–100 °C közötti hőmérsékleten végezzük.

Oxo-vegyületként előnyösen aldehideket, így például acetaldehidet, butir- vagy izobutir-, benz-, 3-klór-benz-, 3,4-diklór-benz-, 4-klór-benz-, 4-metoxi-benz-, 3- és 4-fluor-benzaldehidet, akroleint, metakroleint, 2-furil-aldehidet, 2-metil-propenil-aldehidet, Δ^3 -ciklohexenil-aldehidet, indolil- vagy sztilil-aldehidet alkalmazunk.

A ketonvegyületek közül előnyös az acetone, ciklopentanon, ciklopenténon, ciklohexanon, metil-etilketon.

Azok az (IB) általános képletű vegyületek, amelyek képletében

R¹ jelentése az (I) általános képletnél megadottakkal azonos,
 R⁶ jelentése 1–6 szénatomos alkil-amino-, 3–6 szénatomos cikloalkil-amino-csoport,

újak. Ezeket az új vegyületeket ismert módszerek szerint állíthatjuk elő, így például, ha (II) általános képletű 3-hidrazino-2H,3H-benzizotiazol-1,1-dioxidot – a képletben R¹ jelentése a fenti – (III) általános képletű izocianáttal – a képletben R⁶ jelentése a fenti – reagáltatunk, adott esetben a fentiekben részletezett valamely inert oldószerben, általában ekvimoláris mennyiségben, normál nyomáson.

A találmány szerinti felhasználható hatóanyagok erős mikrobicid hatással rendelkeznek és előnyösen alkalmazhatók káros mikroorganizmusok kipusztítására. E hatóanyagok a növényvédelemben fungicid szerként használhatók, egyes vegyületeknek baktericid hatásuk is van.

A növényvédelemben így fungicid szerként használhatjuk őket például a Plasmodiophoromycete, Oomycete, Chytridiomycete, Zygomycete, Ascomycete, Basidiomycete, Deuteromycete törzsek ellen.

A hatóanyagok növényekkel való összeférhetősége igen jó, így a betegségek leküzdésénél a kívánt koncentrációban akár a lombzaton, akár a palántákon vagy magokon, akár pedig a talajban használhatók.

A találmány szerinti készítmények lehetnek oldatok, emulziók, szuszpenziók, porok, habok, paszták, granulátumok, aeroszolok, műanyagalapú mikrokapszulák, valamint vetőmagok bevonó anyagai és ULV-készítmények is.

Ezeket a készítményeket ismert módon állítjuk elő, azaz úgy, hogy a hatóanyagok hígítóanyagokkal azaz folyékony oldószerekkel, nyomás alatti gázokkal és/vagy szilárd hordozóanyagokkal, adott esetben felületaktív anyagok, így például emulgeátorok és/vagy diszpergálószeres és/vagy habképző anyagok jelenlétében elkeverjük. Amennyiben oldószerként vizet használunk, segédoldószerként valamely szerves oldószer kerülhet még alkalmazásra. Folyékony oldószerként például a következőket használhatjuk: aromás vegyületek, így például xilol, toluol vagy alkil-naftalinok, klórozott aromás vagy alifás szénhidrogének, így például klór-benzol, klór-etilén vagy metilén-klorid, alifás szénhidrogének, így például ciklohexán vagy paraffin, így például különböző nyersolajfrakciók, alkoholok, így például butanol vagy glikol valamint ezek észterei vagy éterei, ketonok, így például acetone, metil-etil-ke-ton, metil-izobutil-ke-ton vagy ciklohexanon, erősen poláros oldószerek, így például dimetil-szulfoxid vagy dimetil-formamid, valamint víz. Folyósított gázformájú hígítóanyagokon vagy hordozóanyagon olyan anyagokat értünk, amelyek normál hőmérsékleten és normál nyomáson gáz-halmazállapotúak mint például az aeroszol-hajtóanyagok, például a halogén-szénhidrogének, valamint a bután, propán, nitroén vagy széndioxid. Szilárd hordozóanyagként például a következőket használhatjuk: természetes kőzetlisztek, így például kaolin, agyagok, talkum; -kréta, kvarc, attapulgit, montmorillonit, vagy diatomaföld; szerves kőzetlisztek, így például nagydiszperzitású kovásva, alumínium-oxid vagy szilikátok. Granulátumok céljára például a következő szilárd hordozóanyagokat használhatjuk: aprított és frakcionált természetes kőzetek, így például kalcit, márvány, tufa, szepiolit, dolomit, valamint szintetikus granulátumok szerves vagy szerves őrleményekből, valamint szerves anyagok, így például fűrészpor, kókuszdióhéj, kukoricacsutka vagy dohányászár őrleményei. Emulgeáló és/vagy habképző anyagként használhatjuk például a következőket: nemionos vagy ionos emulgeátorok, így például poli(oxi-etilén)-zsírsav-észterek, poli(oxi-etilén)-zsr-alkohol-éterek, így például alkil-aril-poliglikol-éter, alkil-szulfonátok, alkil-szulfátok, aril-szulfonátok, fehérje-hidrolizátumok. Diszpergálószerként például lignin-szulfitszenylyűgot vagy metil-cellulózt használhatunk.

A találmány szerinti készítmények tartalmazhatnak különböző ragasztóanyagokat, így például kar-

boxil-metil-cellulózt, természetes vagy szintetikus por-, szemcse- vagy latex-formájú polimereket, így például gumiarabikumot, poli(vinil-alkoholt), poli(vinil-acetátot), valamint természetes foszfolipideket, így például kefalint vagy lecitint, továbbá szintetikus foszfolipideket. Segédanyagként még különböző növényi és ásványi olajokat is használhatunk.

A találmány szerinti készítmények tartalmazhatnak továbbá színezékeket is, így például szerves pigmenteket, például vas-oxidot, titán-oxidot, ferrociankéket, valamint szerves színezékeket, például alizarin-, azo- vagy fém-ftalocianin-színezékeket, továbbá nyomelemeket, így például különböző vas-, mangán-, bór-, réz-, kobalt-, molibdén- vagy cink-sókat.

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

A találmány szerinti készítmények ismert más hatóanyagokkal, így például fungicidekkel, inszekticidekkel, akaricidekkel, valamint szelektív herbicidekkel, trágyázószerekkel és növekedésszabályozókkal keverhetők és együtt felhasználhatók.

A találmány szerinti hatóanyagot valamely készítmény, vagy abból készült felhasználásra kész készítmény, így például felhasználásra kész oldatok, emulgeálható koncentrátumok, emulziók, habok, szuszpenziók, permetporok, paszták, oldható porok, porozószerek és granulátumok formájában alkalmazzuk. A felvitelt ismert eljárások, így például öntés, permetezés, szórás, porlasztás, porozás, habosítás, bevonás útján végezzük. Lehetőség van továbbá a hatóanyag ULV-készítmény formájában történő felvitelére, vagy arra is, hogy készítményt közvetlenül a talajba injektáljuk, de használhatjuk azokat a vetőmagon vagy a növényeken is.

A növényi részek kezelésekor felhasznált készítmények hatóanyagtartalma széles határok között változhat, így értéke 1–0,0001, előnyösen 0,5–0,001 tömeg% között lehet.

A vetőmagokon történő kezelés esetén a hatóanyagmennyiség 0,001–50 g, előnyösen 0,01–10 g vetőmag-kilogrammonként.

Közvetlen talajkezelés esetén a hatóanyagkoncentráció a kívánt helyen 0,00001–0,1, előnyösen 0,0001–0,02 tömeg%.

A továbbiakban a találmányt részletesebben példákkal illusztráljuk. Az összehasonlító vegyületként az (A) képletnek megfelelő ismert vegyületet alkalmaztuk.

A példa

Pyricularia-vizsgálat rizsnél (protektív)

Oldószer: 12,5 tömegrész acetone,

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

A vizsgálatokhoz 1 tömegrész hatóanyagot a fentiekben megadott oldószerrel hígítunk és vízzel, valamint a fenti mennyiségű emulgeátorral a kívánt koncentrációra állítunk be.

A protektív hatás vizsgálatához fiatal rizspalántákat a fenti hatóanyagkészítménnyel cseppnedvesre permetezünk, majd szárítás után a növényeket *Pyricularia oryzae* vizes spóraszuszpenziójával beoltjuk, és a növényeket melegházban 100 % relatív nedvességtartalom mellett 25 °C-on tartjuk.

4 nappal a beoltás után kiértékeljük a megbetegedési mértékét.

A kapott eredményeket a következő A táblázatban foglaltuk össze.

A táblázat

Pyricularia-vizsgálat rizsnél (protektív)

Hatóanyag	Hatóanyag-koncentráció %ban	Megbetegedés a kezeletlen kontroll %-ában
(A) képletű ismert vegyület	0,025	25
(a) képletű vegyület	0,025	10
(b) képletű vegyület	0,025	30
(c) képletű vegyület	0,025	20
(d) képletű vegyület	0,025	20

B példa

Pyricularia-vizsgálat rizsnél (szisztemikus)

Oldószer: 12,5 tömegrész aceton

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

A vizsgálatokhoz 1 tömegrész hatóanyagot a fentiekben megadott oldószerrel hígítjuk, majd vízzel és a megadott mennyiségű emulgeátorral a kívánt koncentrációra állítjuk be.

Célszerűen 0,1–0,25 t%-os oldatot készítünk, de megjegyezzük, hogy a készítmény koncentrációja nem döntő, lényeges a felületegységre felvitt hatóanyag mennyisége.

A szisztemikus hatás vizsgálatához 40 ml hatóanyagkészítményt egységnyi mennyiségű talajra öntünk, amelyben fiatal rizspalántákat neveltünk. 7 nappal a kezelés után a növényeket melegházban 25 °C hőmérsékleten 100 % relatív nedvesség-tartalom mellett tartjuk.

4 nappal a beoltás után kiértékeljük a megbetegedési mértékét.

A kapott eredményeket a következő B táblázatban foglaltuk össze.

B táblázat

Vizsgálat rizsnél (szisztemikus)

Hatóanyag	Felhasznált hatóanyag 100 cm ² -en mg-ban	Megbetegedés a kezeletlen kontroll %-ában
5		
10		
15	(A) képletű ismert vegyület	100 50
20	(a) képletű vegyület	100 22
	(b) képletű vegyület	100 20
25	(3) képletű vegyület	100 10
	(e) képletű vegyület	100 20
30	(c) képletű vegyület	100 33
	(d) képletű vegyület	100 11
35	(f) képletű vegyület	100 22

40

Előállítási példák

1. példa

d) képletű vegyület előállítása

45

50

55

9,8 g (0,05 mól) 3-hidrazino-2H,3H-benzizotiazol-1,1-dioxidot acetánhidrid felesleggel (15 g) reagáltatunk, miközben a hőmérsékletet lassan 60 °C-ra emeljük. 2 óra elteltével a reakciókeveréket lehűtjük, betöményítjük és a maradékot etanolból átkristályosítjuk. Ily módon 0,4 g (79 %) 3-(acetylhidrazino)-benzizotiazol-1,1-dioxidot nyerünk, olvadáspontja 274 °C.

2. példa

(2) képletű vegyület

60

65

9,8 g (0,05 mól) 3-hidrazino-2H,3H-benzizotiazol-1,1-dioxidot 100 ml dioxánban 6 g (0,05 mól) trietilammal reagáltatunk keverés közben, majd

hozzáadunk 25 ml dioxánban oldott 8,6 g (0,55 mól) fenoxi-karbonil-kloridot. Körülbelül 2 óra után a kiváló sőt leszívjuk, hideg dioxánnal mossuk és az egyesített anyalóg-adagokat betöményítjük. A maradékot etanolból átkristályosítva nyerjük a cím szerinti 3-(fenoxi-karbonil-hidrazino)-2H,3H-benzizotiazol-1,1-dioxidot (12,8 g 81%), olvadáspontja 216 °C.

3. példa

(3) képletű vegyület előállítása

9,8 g (0,05 mól) 3-hidrazino-2H,3H-benzizotiazol-1,1-dioxidot 100 ml dioxánban oldunk és szobahőmérsékleten hozzáadunk 3,7 g (0,55 mól) metilzocianátot 30 ml dioxánban oldva, és egy órai keverés után a reakciókeveréket leszívjuk. Ily módon 11,8 g (89 %) 3-(metil-amino-karbonil-hidrazino)-benzizotiazol-1,1-dioxidot nyerünk, olvadáspontja 183 °C. A terméket etanolból átkristályosítva tisztítjuk.

Az 1–3. példákban leírtakhoz hasonlóan állítjuk elő a (4) általános képletű vegyületeket, amelyeket a következő táblázatban foglaltunk össze:

1. táblázat

(4) általános képletű vegyületek

Példa száma	R ¹	R ³	Olvadáspont (°C)
4	H	-CH ₃	274
5	CH ₃	-CH ₃	193
6	H	-C ₂ H ₅	211
7	CH ₃	-C ₂ H ₅	189
8	H	-C ₃ H ₇ -n	110
9	H	-C ₆ H ₅ (f) képletű vegyület	272
10	H	-CH ₂ -C ₆ H ₅	232
11	H	-CH ₂ -O-C ₆ H ₅	239
12	H	-O-CH ₃	211
13	H	-O-C ₂ H ₅	207
14	CH ₃	-O-C ₂ H ₅	191
15	H	OC ₆ H ₅	216
16	H	-O-C ₆ H ₄ -Cl	227
17	H	-NH-C ₃ H ₇ -izo (a) képletű vegyület	240
18	H	-NH-C ₆ H ₁₁ (b) képletű vegyület	220
19	H	-NH-C ₆ H ₅ (e) képletű vegyület	208

20. példa

c) képletű vegyület előállítása

19,7 g (0,1 mól) 3-hidrazino-2H,3H-benzizotiazol-1,1-dioxidot 200 ml dioxánban oldunk 40–50 °C-on, majd intenzív keverés közben hozzáadunk 8 g (0,11 mól) izobutiraldehidet, amikor rögtön csapadékkiválás indul meg. Kb. 20 perc elteltével, az adagolás befejezése után a reakciókeveréket 80–90 °C-ra melegítjük, majd lehűtjük és a kiváló csapadékot leszívjuk. Ily módon 22,1 g (88,1 %) 3-izobutilidén-hidrazino-benzizotiazol-1,1-dioxidot nyerünk, olvadáspontja 225 °C.

21. példa

A 21. példánál leírtak szerint eljárva a 0,1 mólos mennyiséget 13,2 g (0,11 mól) 4-metil-benzaldehyddel reagáltatva 24,3 g (81 %) 3-[4-metil-benzilidén-hidrazino]-benzizotiazol-1,1-dioxidot nyerünk, olvadáspontja 294 °C.

22. példa

A 21. példa szerint eljárva a 0,1 mólos mennyiséget 0,2 mól metakroleinnel reagáltatva 15,2 g (61 %) 3-(2-metil-allilidén-hidrazino)-benzizotiazol-1,1-dioxidot nyerünk, olvadáspontja 224 °C.

A 21–23. példánál leírtak szerint eljárva állítjuk elő a (6) általános képletnek megfelelő vegyületeket, amelyeket a következő táblázatban foglaltunk össze:

2. táblázat

(6) általános képletű vegyület

Példa száma	R ⁴	R ⁵	Olvadáspont (°C)
23	H	CH ₂ =C(CH ₃)-	224
24	H	CH ₃ CH=CH-	196
25	H	2-furil	257
26	H	CH ₃ CH=C(CH ₃)-	262
27	H	Δ ³ -ciklohexenil	221
28	H	C ₆ H ₅ CH=CH-	260
29	H	-CH(CH ₃) ₂	225
30	CH ₃	-CH ₃	215
31		ciklopentilidén*	231
32		ciklohexilidén*	177
33	H	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ -	321
34	H	3-Cl-C ₆ H ₄ -	306

A 2. táblázat folytatása

Példa száma	R ⁴	R ⁵	Olvadáspont (°C)
35	H	4-Cl-C ₆ H ₄ -	315
36	H	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄ -	264
37	H	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄ -	281
38	H	4-F-C ₆ H ₄ -	302
39	H	3-F-C ₆ H ₄ -	318
40	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	294
41	H	C ₆ H ₅ -	287

* R⁴ és R⁵ együtt a kapcsolódó szénatommal

Készítmény előállítási példák

1. Porozószer

5 trész 1. példa szerinti hatóanyagot elkeverünk 95 trész természetes közetliszttel és porfinomságúra őrljük.

Az így nyert készítményt visszük fel a kívánt mennyiségben a növényekre.

2. Diszpergálható porkészítmény

a) 50 trész 3. példa szerinti hatóanyagot elkeverünk 1 trész dibutil-naftalinszulfonáttal, 4 trész ligninszulfonáttal, 8 trész nagydiszperzitású kovasavval, valamint 37 trész természetes közetliszttel és finom porrá őrljük.

Felhasználásnál a kapott poranyagot olyan mennyiségű vízzel hígítjuk, hogy a kívánt koncentrációjú készítményt nyerjük.

b) 90 trész 4. példa szerinti hatóanyagot elkeverünk 1 trész dibutil-naftalinszulfonáttal, 5 trész Naligninszulfonáttal, 2 trész nagydiszperzitású kovasavval és 2 trész természetes közetliszttel és finom porrá őrljük.

Felhasználásnál az előző pontban leírtak szerint járunk el.

3. Emulgeálható koncentrátum

25 trész 8. példa szerinti hatóanyagot 55 trész xilol és 10 trész ciklohexanon elegyében oldunk 10 trész emulgeátor (dodecil-benzolszulfonsavas-kalcium

és nonil-fenol-poliglikol-éter 1:1 keveréke) jelenlétében.

Az így nyert koncentrátumot felhasználásnál a kívánt koncentrációra hígítjuk.

4. Granulátum készítmény

91 trész homokot (0,5–1,0 mm), 2 trész orsóolajat és 7 trész hatóanyag-előkeverékét (75 trész 30. példa szerinti hatóanyag + 20 trész természetes közetliszt) alkalmas keverőben addig keverünk, amíg egyenletes eloszlású, nem porzó granulátumot nyerünk.

Szabadalmi igénypontok

1. Fungicid készítmény, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként (I) általános képletű 3-hidrazinobenzizotiazol-1,1-dioxid-származékokat – a képletben

R¹ jelentése hidrogénatom,
R² jelentése –CO–R³ csoport, amely képletben R³ jelentése 1–4 szénatomos alkil-, (1–4 szénatomos alkil)-amino-, (5–6 szénatomos cikloalkil-amino-fenil- vagy fenil-amino-csoport, vagy R¹ és R² jelentése együtt =CR⁴R⁵ csoport, amelyben R⁴ jelentése hidrogénatom, és R⁵ jelentése 1–4 szénatomos alkilcsoport –

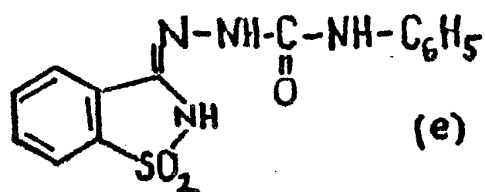
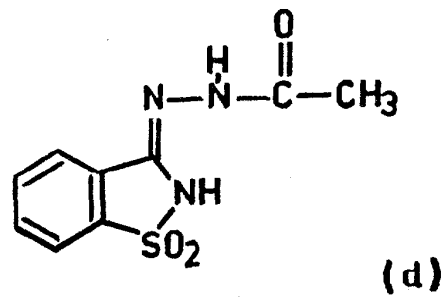
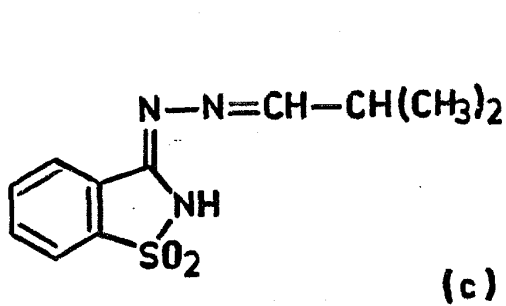
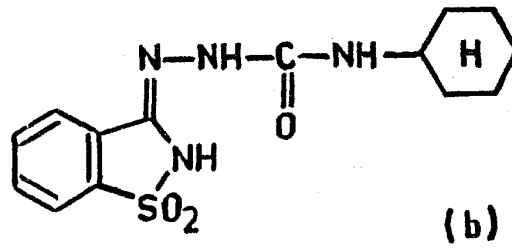
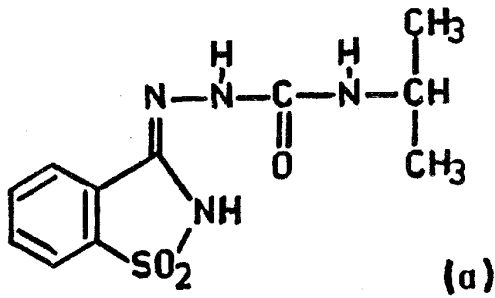
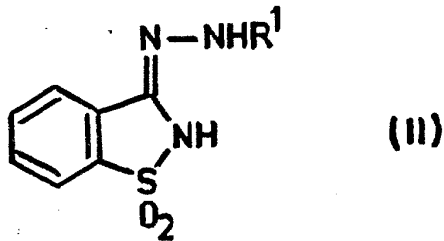
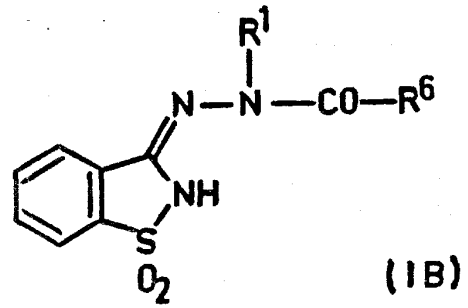
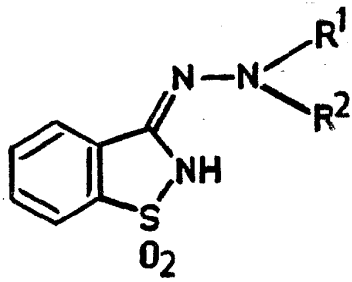
tartalmaz 0,1–95, előnyösen 0,5–90 t% mennyiségben egy vagy több szilárd hordozó, célszerűen természetes közetlisztek vagy ezeknek megfelelő szintetikus anyagok őrléménye és/vagy folyékony hordozó, célszerűen szerves vagy szervetlen oldószerek és/vagy segédanyagok, célszerűen felületaktív anyagok, célszerűen ionos vagy nemionos anyagok mellett.

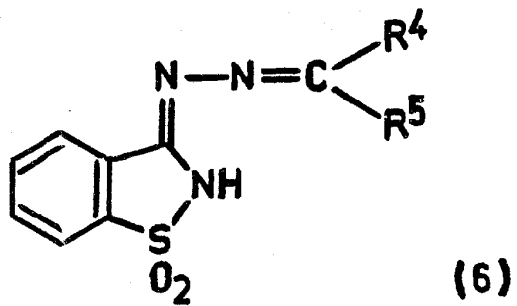
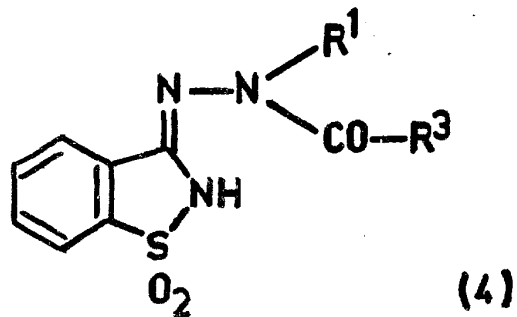
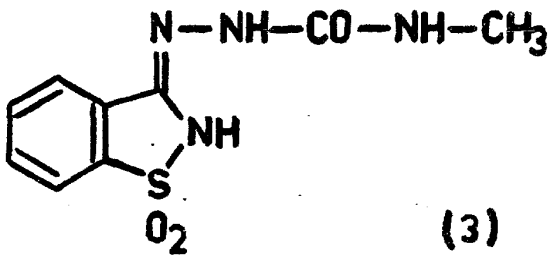
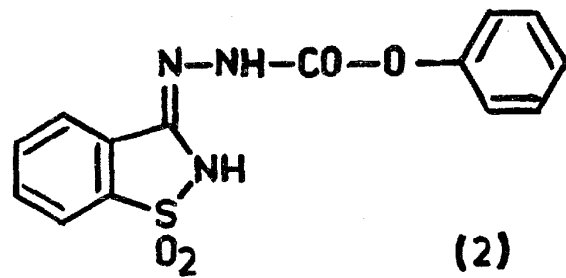
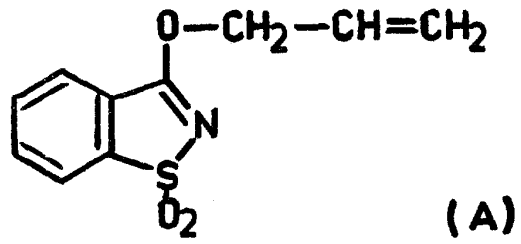
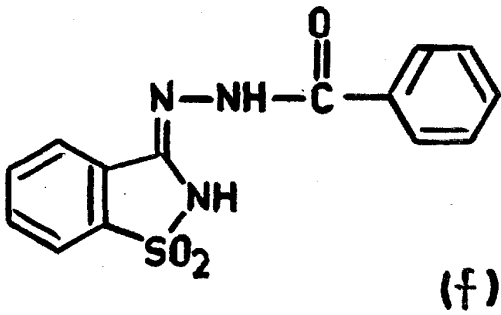
2. Eljárás új (IB) általános képletű 3-hidrazinobenzizotiazol-1,1-dioxid-származékok – a képletben

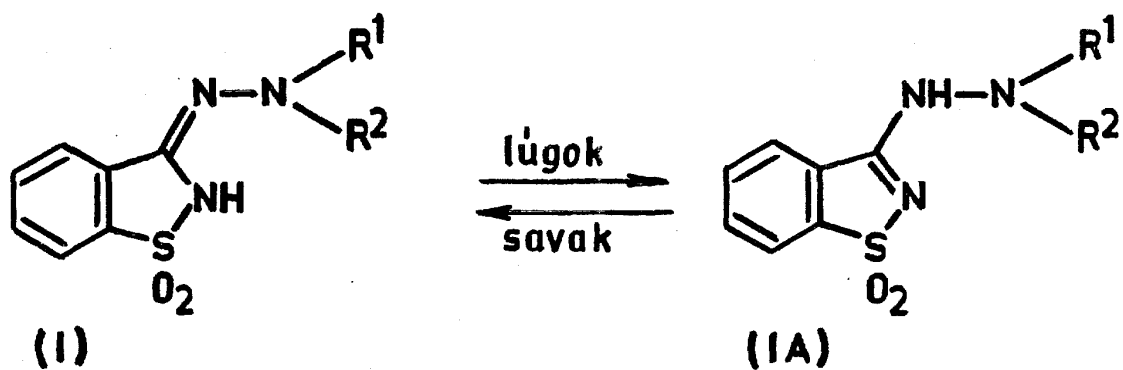
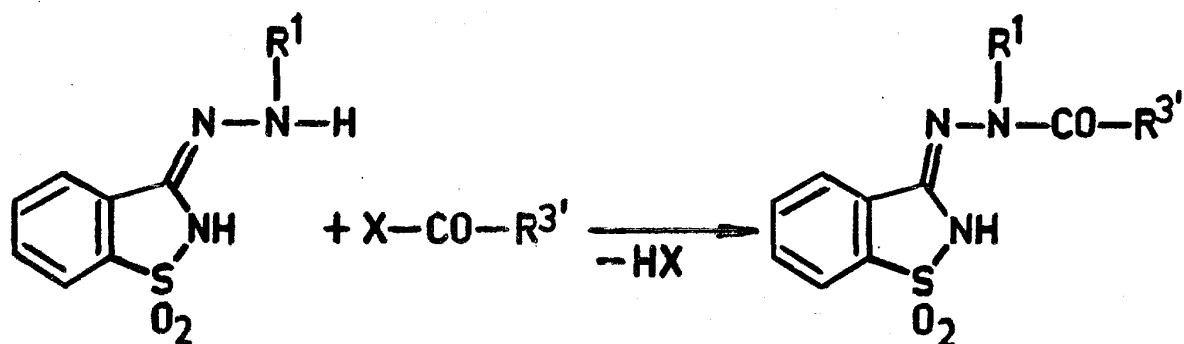
R¹ jelentése hidrogénatom,
R⁶ jelentése 1–6 szénatomos alkil-amino- vagy 3–6 szénatomos cikloalkil-amino-csoport,

azzal jellemezve, hogy (II) általános képletű 3-hidrazino-2H,3H-benzizotiazolt – a képletben R¹ jelentése a fenti – (III) általános képletű izocianátokká – a képletben R⁶ jelentése a fenti – reagáltatunk adott esetben szerves oldószer jelenlétében.

3 db ábra





A reakcióvázlat**B reakcióvázlat****C reakcióvázlat**