

NORGE



STYRET
FOR DET INDUSTRIELLE
RETTSVERN

Utlekningsskrift nr. 126952

Int. Cl. C 07 d 33/44 Kl. 12p-1/10
A 01 n 9/22 45 1-9/22

Patentsøknad nr. 2650/69 Inngitt 25.6.1969

Løpedag -

Søknaden alment tilgjengelig fra 29.12.1969

Søknaden utlagt og utlegningsskrift utgitt 16.4.1973

Prioritet begjært fra: 26.6.1968 Frankrike,
nr. 156668

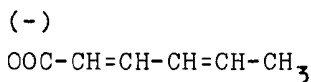
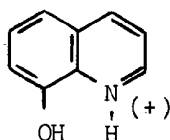
N.V. Philips' Gloeilampenfabrieken,
Kastanjelaan 1, Eindhoven, Nederland.

Oppfinnere: Jean Heullant, 15 Allée de Verdun,
Le Raincy 93, René Antoine Jean Piat,
46 rue Brisout de Barnevielle, Rouen og
Jean-Pierre Vallier, 26 Avenue de Nielm,
Paris 17, alle: Frankrike.

Fullmektig: Bryns Patentkontor A/S

Addisjonssalt av 8-hydroksykinolin til anvendelse som
fungicid.

Oppfinnelsen vedrører et addisjonssalt av 8-hydroksy-
kinolin til anvendelse som fungicid, idet addisjonssaltet er
karakterisert ved at det har følgende formel



I Pharmazie, volum 18, side 625-629 (1963) er det om-
talt salter av 8-hydroksykinolin, som har en fungicid virkning også
ved sopp som er skadelig for mennesker og dyr. Forbindelsen ifølge
oppfinnelsen har ingen eller bare en liten virkning på dette området,

126952

men er meget aktiv overfor sopp som er skadelig for planter. Forbindelsen ifølge oppfinnelsen er spesielt egnet til å beskytte frukt mot angrep av sopp.

Det er også tidligere kjent et addisjonssalt av hydroksybenzosyre og 8-hydroksykinolin som er egnet til å anvendes ved konservering av papir på grunn av dets aktivitet overfor *Aerobacter aerogenes*, *Bacilles mycoides* og *Penicillium expansum*. Denne forbindelse har ingen praktisk betydning som beskyttelsesmiddel for frukt, mens forbindelsen ifølge oppfinnelsen er meget godt egnet til å anvendes ved konservering av frukt på grunn av dens aktivitet mot f.eks. *Gloeosporium perennans*, *Gloeosporium album* og *Gloeosporium musarum*.

En foretrukken form for fremstilling av addisjonssaltet ifølge oppfinnelsen består i en gradvis tilsetning av syren til smeltet 8-hydroksykinolin. Denne fremgangsmåte skal i det følgende omtales ved hjelp av et eksempel.

29,3 gram (0,2 mol) 8-hydroksykinolin ble oppvarmet på et oljebad. Etterat stoffet hadde smeltet og fått en temperatur fra 80 til 85°C, ble 22,4 gram (0,2 mol) sorbinsyre tilsatt i små mengder under røring.

Man fikk fremstilt et orangerødt stoff. Etterat tilsetningen var ferdig ble røringen fortsatt samtidig som temperaturen gradvis ble hevet til 110°C, hvorved man oppnådde en homogen væske som så ble helt ut over en glassplate. Etter avkjøling fikk man en meget hard masse med en hvit farge, og denne masse ble finmalt til et krystallinsk pulver med et smeltepunkt fra 66,5 til 67°C.

Utbyttet var 98%.

pH-verdien av en 0,2% vandig suspensjon var 4,65. Ved 25°C er løseligheten pr. liter mindre enn 2 gram i vann, 245 gram i etanol, 280 gram i aceton og 69 gram i benzen.

Det nye salt har interessante bakteriostatiske og fungistatiske egenskaper, spesielt ved bekjempelse av sopp og gjærende bakterier i og på naturlige produkter (*Gloeosporium perennans*, *Gloeosporium album*, *Gloeosporium musarum*, etc.). Stoffets fungicidale effekt på mycelveksten i et kulturmedium er sammenlignbar med det man oppnår for tiabendazol, som hittil har vært ansett for det beste fungicid for å beskytte konserverte frukt. Aktiviteten for sammensetningen ifølge foreliggende oppfinnelse er større enn den man finner for captan, et meget kjent fungicid for denne type infeksjoner. Sor-

binsyre selv har meget liten aktivitet overfor nevnte sopper, og nevnte derivater av 8-hydroksykinolin eller kobbersaltet av 8-hydroksykinolin har relativt god aktivitet. Resultatet oppnådd ved en kombinasjon av sorbinsyre og 8-hydroksykinolin er imidlertid betydelig bedre enn det som kunne forventes på basis av de separate forbindelsers egenskaper, noe som i praksis betyr at man kan anvende betydelig lavere doser enn det som hittil har vært normalt for 8-hydroksykinolin.

De fungicide egenskaper for ovennevnte salt er ikke begrenset til de ovennevnte formål. På grunn av produktets uskadelige natur kan det anvendes for beskyttelse av matvarer, spesielt ved lagring av disse, foruten som et generelt fungicid i industrier hvor man anvender naturlige produkter som råmaterialer, f.eks. i såpeindustrien, den kosmetiske industri, papirindustrien etc.

I det etterfølgende vil forskjellige former bli beskrevet etter forskjellige anvendelsesformål, dvs. fuktbare sammensetninger, støv, blandbare oljer, oppløsninger for sprøyting i ren tilstand eller etter fortynning med vann, og hvor nevnte sammensetninger inneholder fra 0,1 til 95 vekt% av det aktive stoff.

Eksempel I: Fuktbare pulvere.

8-hydroksykinolinsorbat	50%
Blanding av jordalkali-alkylaryl-sulfonat og alkylfenol-polyoksyetylen	5%
Natrium-lignosulfonat	2%
Resten er mineralbærestoffer såsom kaolin eller kalk.	

De anvendte doser vil være avhengig av de infeksjoner som skal bekjempes. For behandling av frukttrær før første plukking eller for konservering av frukt, vil mengden av det fuktbare pulver pr. hektoliter vann variere fra 100 til 200 gram.

Eksempel II: Blandbare oljer.

8-hydroksykinolinsorbat	15%
Blanding av jordalkali-alkylaryl-sulfonat og alkylfenol-polyoksyetylen	4 til 5%
Aceton	50%
Resten: benzen eller nafta.	

Denne sammensetning er spesielt brukbar for sprøyting av frø i doser fra 200 til 300 ml/100 kg frø.

126952

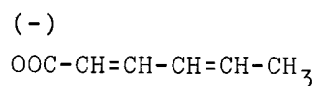
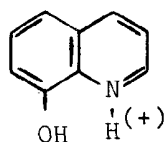
Eksempel III: Rene oppløsninger.

Ettersom 8-hydroksykinolinsorbat har meget stor løselighet i polare oppløsningsmidler såsom aceton eller etanol, kan man fremstille hele serier av oppløsninger som er umiddelbart ferdige for bruk, og hvor konsentrasjonen av det aktive stoff kan være fra 25 til 28%.

Disse oppløsninger er spesielt interessante for behandling av papirmasse og rent papir.

P a t e n t k r a v :

Addisjonssalt av 8-hydroksykinolin til anvendelse som fungicid, k a r a k t e r i s e r t ved at det har følgende formel:



Anførte publikasjoner:

Alment tilgjengelig norsk søknad nr. 1981/69
 Pharmazie, vol. 18 s. 625-629 (1963)
 Merck Index, 8. utg. s. 971 (1968)
 Belgisk patent nr. 558 977