

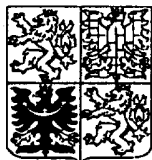
# PATENTOVÝ SPIS

(11) Číslo dokumentu:

**285 353**

(19)

ČESKÁ  
REPUBLIKA



ÚŘAD  
PRŮMYSLOVÉHO  
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: **2287-92**

(22) Přihlášeno: **22. 07. 92**

(30) Právo přednosti:  
**22. 07. 91 DE 91/4124255**

(40) Zveřejněno: **17. 02. 93**  
(Věstník č. 2/93)

(47) Uděleno: **19. 05. 99**

(24) Oznámeno udělení ve Věstníku: **14. 07. 99**  
(Věstník č. 7/99)

(13) Druh dokumentu: **B6**

(51) Int. Cl.<sup>6</sup>:  
**A 01 N 37/50**  
// (A 01 N 37/50,  
A 01 N 43:84, A 01 N 43:40,  
A 01 N 33:08)

(73) Majitel patentu:

**BASF AKTIENGESELLSCHAFT,**  
Ludwigshafen, DE;

(72) Původce vynálezu:

**Sauter Hubert dr., Mannheim, DE;**  
**Schelberger Klaus, Goennheim, DE;**  
**Lorenz Gisela dr., Neustadt, DE;**  
**Ammermann Eberhard dr., Heppenheim,**  
**DE;**

(74) Zástupce:

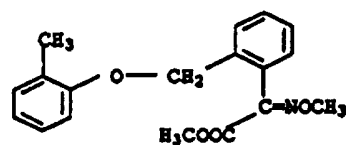
**Koreček Ivan JUDr. Advokátní a patentová**  
**kancelář, Na baště sv. Jiří 9, Praha 6,**  
**16000;**

(54) Název vynálezu:

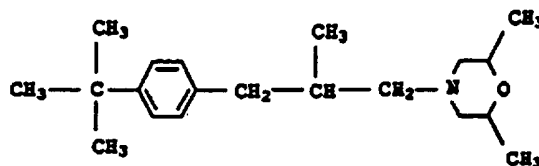
**Fungicidní prostředek a způsob**  
**potlačování hub jeho použitím**

(57) Anotace:

Fungicidní prostředek je tvořen fungicidní směsí sestávající z (a) methylesteru kyseliny  $\alpha$ -methoximino-2-[(2-methylfenoxy)methyl]fenyloctové vzorce I a (b) 4-[2-methyl-3-(4-terc.-butylfenyl)propyl]-2,6-dimethylmorfolinu (fenpropimorphu) vzorce II nebo účinné látky tridemorph nebo účinné látky fenpropi-din. Hmotnostní poměr sloučenin a:b je 10:1 až 1:10.



(I)



(II)

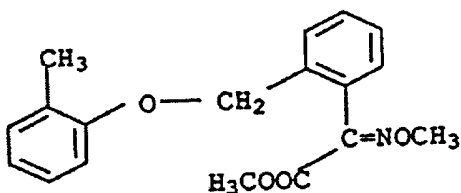
**Fungicidní prostředek a způsob potlačování hub jeho použitím**Oblast techniky

5

Tento vynález se týká fungicidního prostředku, tvořeného směsí látek se synergickým fungicidním účinkem, a způsobu potlačování hub pomocí tohoto prostředku.

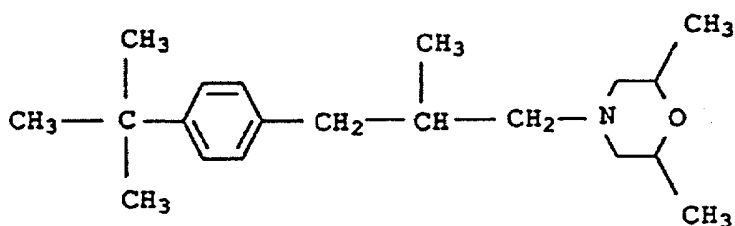
10 Dosavadní stav techniky

Je známo, že methylester kyseliny  $\alpha$ -methoximino-2-[(2-methylfenoxy)methyl]fenyloctové vzorce



15

používá jako fungicid (evropský patent č. 253 213). Dále je známo použití účinné látky 4-[2-methyl-3-(4-terc.-butylfenyl)propyl]-2,6-dimethylmorfolinu vzorce



20

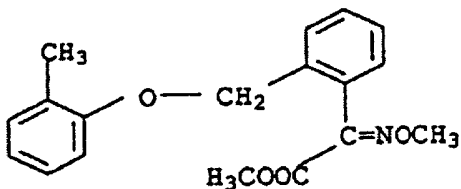
účinné látky tridemorph nebo účinné látky fenpropidin nebo jejich solí jako fungicidů (DE spis č. 26 56 747).

25 Podstata vynálezu

Nyní bylo nalezeno, že směs sestávající z

a) methylesteru kyseliny  $\alpha$ -methoximino-2-[(2-methylfenoxy)methyl]fenyloctové vzorce

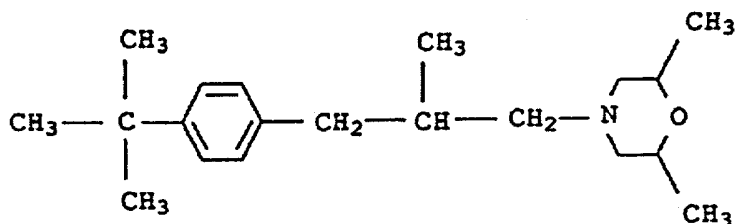
30



a

b) 4-[2-methyl-3-(4-terc.-butylfenyl)propyl]-2,6-dimethylmorfolinu (fenpropimorphu) vzorce

35



nebo účinné látky tridemorph nebo účinné látky fenpropidin ve hmotnostním poměru sloučeniny a:b, jako 10:1 až 1:10, má synergický fungicidní účinek. Poměr (hmotnostní poměr sloučeniny a) a b) ve směsi se volí tak, aby nastal synergický fungicidní účinek. Poměr sloučeniny a) ke sloučenině b) je 10:1 až 1:10, jako například 5:1 až 1:5, zvláště 3:1 až 1:3, s výhodou 2:1 až 1:2.

Synergický účinek směsi se projevuje v tom, že fungicidní účinek směsi sloučeniny a) a sloučeniny b) je větší, než jaký je součet fungicidního účinku sloučeniny a) a fungicidního účinku sloučeniny b).

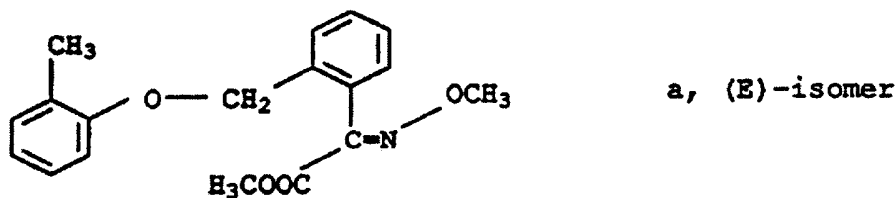
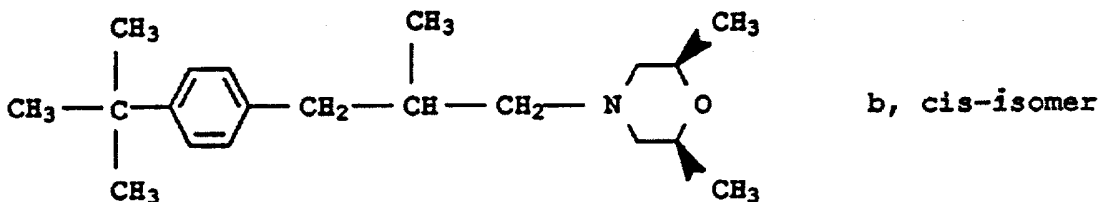
Složka a) může být s ohledem na dvojnou vazbu  $\text{C}=\text{N}$  ve dvou stereoisomerních formách. Výhodný je (E) isomer.

Tento vynález zahrnuje směsi, které obsahují čisté isomery sloučeniny a), zvláště (E) isomer, stejně jako směsi obsahující směsi isomerů.

Složka fenpropimorph může být ve dvou stereoisomerních formách (morfolinový kruh), přičemž cis-isomer je výhodný.

Vynález zahrnuje směsi, které obsahují čisté isomery sloučeniny fenpropimorph, zvláště cis-isomer a směsi, které obsahují směsi isomerů.

Výhodné jsou takové směsi, které složku a) obsahují převážně ve formě (E) isomeru a současně složku b) převážně jako cis-isomer:



Účinná látka fenpropimorph (složka b) může také být ve formě své soli. Také tyto směsi jsou zahrnuty do vynálezu.

Soli se vyrábějí reakcí s kyselinami, například s kyselinami halogenovodíkovými, jako je kyselina fluorovodíková, kyselina chlorovodíková, kyselina bromovodíková nebo kyselina jodovodíková, nebo s kyselinou sírovou, kyselinou fosforečnou nebo kyselinou dusičnou nebo s organickými kyselinami, jako je kyselina octová, kyselina trifluoroctová, kyselina

trichloroctová, kyselina propionová, kyselina glykolová, kyselina mléčná, kyselina jantarová, kyselina citronová, kyselina benzoová, kyselina skořicová, kyselina oxalová, kyselina mravenčí, kyselina benzensulfonová, kyselina p-toluensulfonová, kyselina methansulfonová, kyselina salicylová, kyselina p-aminosalicylová nebo kyselina 1,2-naftalendisulfonová.

5

#### Využitelnost

Při praktickém provedení se používají s výhodou čisté účinné látky a) a b), ke kterým se mohou přidat také další účinné látky, jako jsou insekticidy, araricidy, nematocidy, herbicidy, další fungicidy, regulátory růstu rostlin a/nebo hnojiva.

10

Fungicidní prostředky podle tohoto vynálezu se mohou například používat ve formě přímo rozstřikovatelných roztoků, prášků, suspenzí, také vysoko procentních vodných, olejových nebo jiných suspenzí nebo disperzí, emulzí, olejových disperzí, past, poprašků, posypů nebo granulátů postřikáním, vytvořením mlhy, poprášením, posypáním nebo pokropením. Aplikační formy se řídí podle účelu použití, v každém případě mají zajistit co nejmenější rozdělení účinných látek podle tohoto vynálezu.

15

Obvykle se rostliny postřikají nebo popráší směsmi účinných látek nebo se těmito směsmi ošetří semena rostlin.

20

Prostředky se vyrábějí o sobě známým způsobem, například nastavením směsi účinných látek rozpouštědly a/nebo nosnými látkami, popřípadě za použití emulgačního činidla a dispergačního činidla, přičemž v případě použití vody jako ředidla se mohou používat také jiná organická rozpouštědla jako pomocná rozpouštědla. Jako pomocné látky pro tyto účely přicházejí v podstatě v úvahu: rozpouštědla, jako aromatické sloučeniny (například xylen), chlorované aromatické látky (například chlorbenzen), parafinické sloučeniny (například frakce z destilace ropy), alkoholy (například methanol nebo butanol), ketony (například cyklohexanon), aminy (například ethanolamin nebo dimethylformamid) a voda, nosné látky jako přírodní kamenné moučky (například kaoliny, jíly, mastek nebo křída) a syntetické kamenné moučky (například vysoce disperzní kyselina křemičitá nebo křemičitany), emulgační činidla, jako neinogenní nebo anionické emulgátory (například polyoxyethylenethery alifatických alkoholů, alkylsulfonáty a arylsulfonáty) a dispergační činidla, jako jsou lignin ze sulfitových odpadních louhů a methylcelulóza.

35

Jako povrchově aktivní látky přicházejí v úvahu alkalické soli, soli alkalických kovů a amonné soli aromatických sulfonových kyselin, jako například soli kyseliny ligninsulfonové, kyseliny fenolsulfonové, kyseliny naftalensulfonové a kyseliny dibutylnaftalensulfonové, stejně jako mastných kyselin, alkylsulfonátů a alkylarylsulfonátů, alkylsulfátů, laurylethersulfáty a sulfátů alifatických alkoholů, jakož i soli sulfonovaného hexadekanolu, heptadekanolu a oktadekanolu, stejně jako soli glykoetherů alifatických alkoholů, kondenzační produkty sulfonovaného naftalenu a jeho derivátů s formaldehydem, kondenzační produkty naftalenu nebo naftalensulfonových kyselin s fenolem a formaldehydem, polyoxyethylenoktylfenolether, ethoxylovaný isooktylfenol, oktylfenol nebo nonylfenol, alkylfenolpolyglykoether, tributylfenylglykoether, alkylarylpolyetheralkoholy, isotridecylalkohol, kondenzační produkty ethylenoxidu s alifatickými alkoholy, ethoxylovaný ricinový olej, polyoxyethylenalkylether nebo polyoxypropylen, acetal polyglykoetheru laurylalkoholu, sorbitester, lignin ze sulfitových výluhů nebo methylcelulóza.

45

Práškové, posypové a poprašové prostředky se mohou vyrábět smícháním nebo společným semletím účinných látek s pevnou nosnou látkou.

50

Granuláty, například povlečené, napuštěné nebo homogenní granuláty, se mohou vyrábět nanesením účinné látky na pevnou nosnou látku.

Pevné nosné látky jsou minerální hlinky, jako je silikagel, kyseliny křemičité, křemelina, křemičitany, mastek, kaolin, vápenec, vápno, křída, bolus, spraš, hlinka, dolomit, rozsivková zemina, síran vápenatý, síran hořečnatý, oxid hořečnatý, rozemleté plastické hmoty, hnojiva, jako síran amonný, fosforečnan amonný, močovina a rostlinné produkty, jako je mouka z obilí, moučka z kůry stromů, dřeva a ořechových skořápek, celulózový prášek a jiné pevné nosné látky. Směsi projevují vynikající účinnost proti širokému spektru rostlinných hub, zvláště ze třídy Ascomyceten a Basidiomyceten. Tyto směsi jsou z části synteticky účinné a mohou se používat jako listové a půdní fungicidní prostředky.

Prostředky mají zvláštní význam pro potlačování řady hub na různých kulturních rostlinách, jako je pšenice, žito, ječmen, oves, rýže, kukuřice, tráva, bavlna, soja, kávovník, cukrová třtina, réva vinná, ovocné stromy a okrasné rostliny a také zelenina, jako jsou okurky, fazol a tykvovité rostliny, stejně jako na semenech těchto rostlin.

Sloučeniny se uplatní, pokud se fungicidně účinným množstvím směsí těchto sloučenin ošetří houby nebo osivo, rostliny, materiály nebo půda, které se mají ochránit před napadením houbami.

Použití se provádí před nebo po infekci materiálů, rostlin nebo semen houbami.

Směsi sloučenin jsou zvláště vhodné pro potlačování těchto rostlinných chorob:

Erysiphe graminis a obilí,  
 25 Erysiphe cichoracearum a Sphaerotheca fuliginea na tyktovitých rostlinách,  
 Podosphaera leucotricha na jabloních,  
 Uncinula necator na révě vinné,  
 druhy Puccinia na obilí,  
 druhy Rhizoctonia na bavlíku a travníkových travinách,  
 30 druhy Ustilago na obilí a třtině cukrové,  
 Venturia inaequalis na jabloních,  
 druhy helminthosporia na obilí,  
 Septoria nodorum na pšenici,  
 Rhynchosporium na obilí,  
 35 Botrytis cinerea na jahodníku a révě vinné,  
 Cercospora arachidicola na podzemnici olejné,  
 Pseudocercospora herpotrichoides na pšenici a ječmeni,  
 Pyricularia oryzae na rýži,  
 Phytophthora infestans na bramborách a rajčatech,  
 40 druhy Fusaria a Verticillia na různých rostlinách,  
 Plasmopara viticola na révě vinné a  
 druhy Alternaria na zelenině a ovoci.

Nové směsi se mohou také používat k ochraně materiálů (ochranně dřeva), například proti Paecilomyces variotii.

Fungicidní prostředek obecně obsahuje od 0,1 do 95 % hmotnostních účinné látky, s výhodou od 0,5 do 90 % hmotnostních účinné látky.

Používané množství směsí podle tohoto vynálezu je vždy podle druhu požadovaného účinku, od 0,01 do 3 kg směsí účinných látek na hektar.

Při ošetřování osiva je zapotřebí obecně používat množství směsí účinných látek od 0,001 do 50 g, s výhodou se používá od 0,01 do 10 g na každý kilogram osiva.

Příklady provedení vynálezu

## Příklad 1

## Eradikativní účinek proti padlí na pšenici

Rostliny pšenice odrůdy „Kanzler“, po vyvinutí stádia třetího listu se ošetří při jednom pokusu padlím *Erysiphe graminis* var. *Tritici*, které není citlivé na fungicidy obsahující ve své molekule triazolovou skupinu, a při dalším pokusu se ošetří padlím, které je citlivé na fungicidy, jež ve své molekule obsahují triazolovou skupinu a po vyvinutí houbového napadení na 5 % plochy listů se ošetří vodným prostředkem účinné látky dané koncentrace. Množství vody odpovídá 400 litrům na hektar. Rostliny se umístí do skleníku na dobu 20 dní a kultivují se za teploty 18 až 22 °C. Poté se provede vyhodnocení stanovením napadené plochy listů v procentech. Tyto hodnoty se přepočítají na stupně účinku. Stupeň účinku při neošetřeném kontrolním stanovení se stanoví jako 0. Stupeň účinku, kdy 0 % plochy listu je napadena houbou, se pokládá za 100. Stupně očekávaného účinku směsi účinných látek se zjistí podle Colbyho vzorce (S. R. Colby, „Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations“, Weeds 15, 20–22 /1967/) a srovnají s pozorovanými stupni účinku.

Hodnoty fungicidního účinku kolísají mezi jednotlivými pokusy, protože na rostlinách v jednotlivých pokusech se projevuje rozdílně silné napadení a tím také vycházejí rozdílné číselné hodnoty fungicidního účinku. Proto se mohou navzájem srovnávat pouze výsledky uvnitř téhož pokusu.

$$\text{Colbyho vzorec: } E = x + y - \frac{x \cdot y}{100}$$

ve kterém

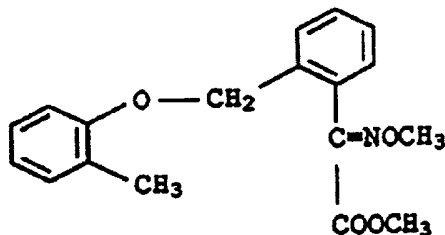
E znamená očekávaný stupeň účinku, vyjádřený v % z neošetřeného kontrolního stanovení, při použití účinné látky A) a účinné látky B) v koncentracích m a n

X znamená očekávaný stupeň účinku, vyjádřený v % z neošetřeného kontrolního stanovení, při použití účinné látky A) v koncentraci m a

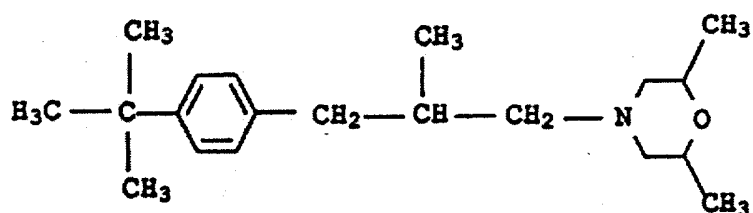
Y znamená očekávaný stupeň účinku, vyjádřený v % z neošetřeného kontrolního stanovení, při použití účinné látky B) v koncentraci n.

## Účinná látka

I. methylester kyseliny  $\alpha$ -methoximino-2-[(2-methylfenyl)oxymethyl]fenyloctové vzorce

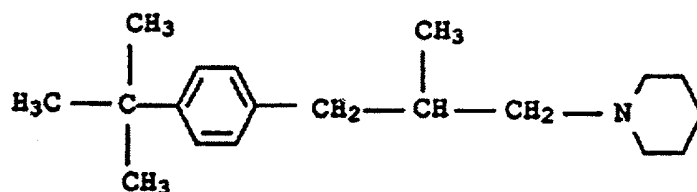


II. Fen-propimorph, 4-[3-(4-terc.-butylfenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethylmorfolin vzorce



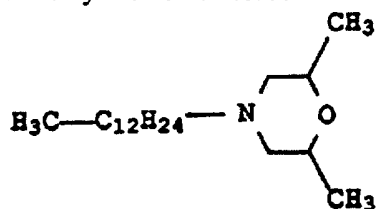
III. fenpropidin, N-[3-(4-terc.-butylfenyl)-2-methylpropyl]piperidin vzorce

5



s

IV. tridemorph, N-tridecyl-2,6-dimethylmorfolin vzorce



10

## Pokus 1

Test eradikativního účinku proti padlí *Erysiphe graminis* na pšenici15 *Erysiphe graminis* resistantní na obsah triazolové skupiny

| Účinná látka                             | Koncentrace účinné látky<br>v postřikovém roztoku v % | Stupeň účinku v % z neošetře-<br>ného kontrolního stanovení |
|------------------------------------------|-------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------|
| Kontrolní stanovení<br>(neošetřeno)      | -                                                     | 0                                                           |
| I.                                       | 0,05                                                  | 40                                                          |
| II. Fenpropimorph                        | 0,05                                                  | 20                                                          |
| III. Fenpropidin                         | 0,05                                                  | 23                                                          |
| IV. Tridemorph                           | 0,05                                                  | 13                                                          |
| Směsi podle tohoto vynálezu              |                                                       |                                                             |
| I. + II. Poměr ve směsi 1:3 0,01 + 0,03  |                                                       | 83                                                          |
| I. + III. Poměr ve směsi 1:3 0,01 + 0,03 |                                                       | 89                                                          |
| I. + IV. Poměr ve směsi 1:3 0,01 + 0,03  |                                                       | 67                                                          |

Výsledky ukazují, že směs s obsahem 0,04 % (0,01 + 0,03 %) účinných látek má lepší fungicidní účinek než 0,05 % jednotlivých účinných látek.

20

Stejný pokus provedený s *Erysiphe graminis* citlivým na obsah triazolové skupiny potvrzuje výsledky pokusu uvedeného výše.

## Pokus 2

Test eradikativního účinku proti padlí *Erysiphe graminis* na pšenici

5 *Erysiphe graminis* resistantní na triazolové skupiny

| Účinná látka                     | Koncentrace účinné látky<br>v postřikovém roztoku v % | Stupeň účinku v % z neošetřeneho kontrolního stanovení |
|----------------------------------|-------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------|
| Kontrolní stanovení (neošetřeno) | -                                                     | 0                                                      |
| I. Účinná látka                  | 0,01                                                  | 65                                                     |
|                                  | 0,001                                                 | 21                                                     |
| II. Fenpropimorph                | 0,1                                                   | 52                                                     |
|                                  | 0,01                                                  | 11                                                     |
| Směs podle tohoto vynálezu       | Pozorovaný stupeň účinku                              | Vypočtený stupeň účinku*)                              |
| I.+II. 0,01 + 0,01               | 55                                                    | 29,7                                                   |
| Poměr ve směsi 1:1               |                                                       |                                                        |
| I.+II. 0,1 + 0,1                 | 100                                                   | 83,2                                                   |
| Poměr ve směsi 1:1               |                                                       |                                                        |
| I.+II. 0,1 + 0,01                | 87                                                    | 68,8                                                   |
| Poměr ve směsi 10:1              |                                                       |                                                        |
| I.+II. 0,01 + 0,1                | 79                                                    | 62,1                                                   |
| Poměr ve směsi 1:10              |                                                       |                                                        |

\*) vypočteno podle Colbyho vzorce

- 10 Stejný pokus provedený s *Erysiphe graminis* citlivým na obsah triazolové skupiny potvrzuje výsledky pokusu uvedeného výše.

Průmyslová využitelnost

15

Použití směsi methylesteru kyseliny  $\alpha$ -methoximino-2-[(2-methylfenoxy)methyl]fenyloctové a 4-[2-methyl-3-(4-terc.-butylfenyl)propyl]-2,6-dimethylmorfolinu ve hmotnostním poměru 10:1 až 1:10 pro výrobu fungicidního prostředku k potlačování hub.

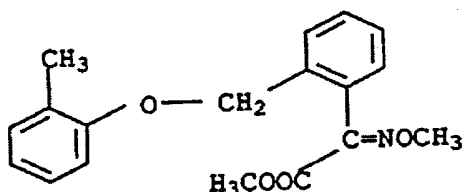
## PATENTOVÉ NÁROKY

5

1. Fungicidní prostředek, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že obsahuje fungicidně účinné množství směsi obsahující

10

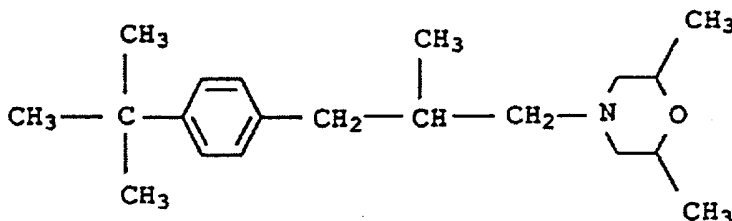
a) methylester kyseliny  $\alpha$ -methoximino-2-[(2-methylfenoxy)methyl]fenyloctové vzorce



a

15

b) 4-[2-methyl-3-(4-terc.-butylfenyl)propyl]-2,6-dimethylmorfolin vzorce



20

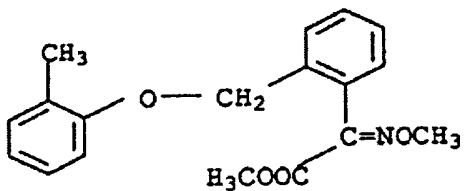
nebo účinnou látku tridemorph nebo účinnou látku fenpropidin, ve hmotnostním poměru sloučeniny a:b 10:1 až 1:10.

2. Fungicidní prostředek podle nároku 1, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že obsahuje sloučeninu a) a b) ve hmotnostním poměru 10:1 až 1:10.

25 3. Fungicidní prostředek podle nároku 1, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že obsahuje sloučeninu a) a b) v hmotnostním poměru a:b 5:1 až 1:5.

30 4. Způsob potlačování hub, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že se na houby nebo na materiály, plochy, rostliny nebo osivo ohrožované napadením houbami nechá působit fungicidně účinné množství směsi obsahující

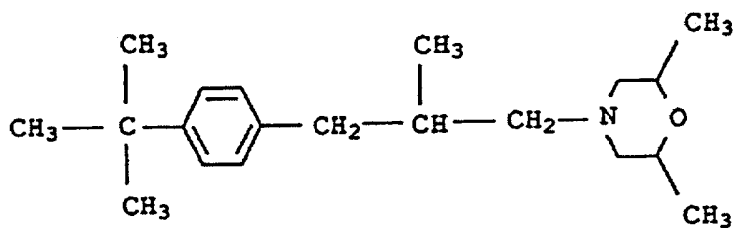
a) methylester kyseliny  $\alpha$ -methoximino-2-[(2-methylfenoxy)methyl]fenyloctové vzorce



35

a

b) 4-[2-methyl-3-(4-terc.-butylfenyl)propyl]-2,6-dimethylmorfolin vzorce



nebo účinnou látku tridemorph nebo účinnou látku fenpropidin v hmotnostním poměru  
sloučeniny a:b 10:1 až 1:10.

5

10

---

Konec dokumentu

---