

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

C07F 9/142

C07C271/20

A01N 57/12

A01N 47/12



[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 99803187.9

[45] 授权公告日 2005 年 8 月 17 日

[11] 授权公告号 CN 1215073C

[22] 申请日 1999.2.18 [21] 申请号 99803187.9

[30] 优先权

[32] 1998. 2. 20 [33] GB [31] 9803491.1

[32] 1998. 5. 22 [33] GB [31] 9810932.5

[86] 国际申请 PCT/GB1999/000338 1999.2.18

[87] 国际公布 WO1999/042468 英 1999.8.26

[85] 进入国家阶段日期 2000.8.21

[71] 专利权人 阿方蒂农科英国有限公司

地址 英国剑桥

[72] 发明人 N·J·德阿坦 J·克洛斯特迈尔

A·希林 M·A·韦布

G·G·布里格斯

审查员 张轶东

[74] 专利代理机构 上海专利商标事务所有限公司

代理人 沙永生

权利要求书 1 页 说明书 4 页

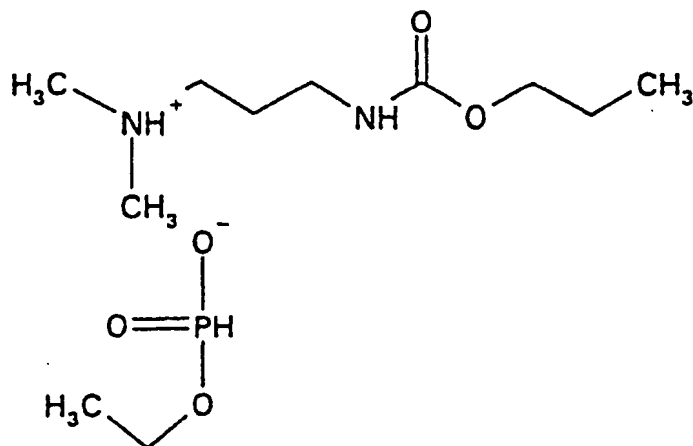
[54] 发明名称 杀真菌剂

[57] 摘要

新的化合物 O-乙基膦酸二甲基 [3-(丙氧基
羰基氨基)丙基] 铵具有杀真菌活性。

I S S N 1 0 0 0 8 - 4 2 7 4

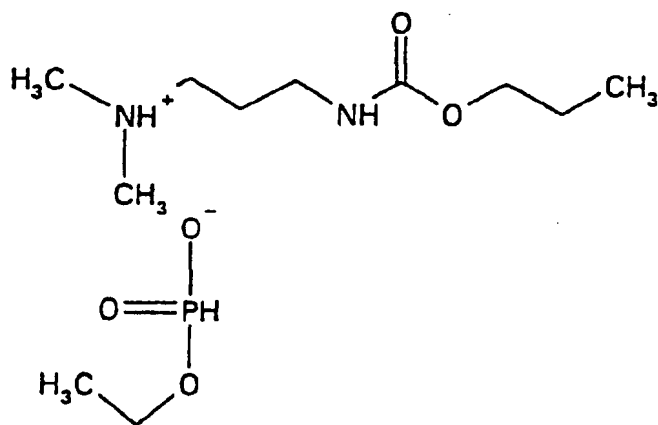
1. 0-乙基磷酸二甲基[3-(丙氧基羰基氨基)丙基]铵, 它具有如下结构:



杀真菌剂

5 本发明涉及具有杀真菌活性的新化合物。

本发明的一个方面提供具有如下结构的化合物，即 0-乙基膦酸二甲基 [3-(丙氧基羰基氨基)丙基]铵



10 本发明的化合物具有杀真菌活性，特别是具有杀植物藻状菌病的活性，如葡萄霜霉病 (*Plasmopara viticola*)、疫霉属疫病 (如西红柿或马铃薯晚疫 (*Phytophthora infestans*))、腐霉属、丝囊霉属 (*Aphanomyces* spp)、盘梗霉属 (*Bremia* spp)、霜霉属 (*Perenospora* spp) 和假霜霉属 (*Pseudoperenospora* spp)。

15 因此，本发明也提供在真菌感染或可能感染的地方防治真菌的方法。该方法包括在所述的地方施加式 I 表示的化合物。

本发明也提供含有式 I 的化合物与农业上可接受的稀释剂或载体混合的农用组合物。

20 本发明的组合物还可含有一种或多种附加的活性成分，如已知具有植物生长调节剂、除草剂、杀真菌剂、杀虫剂或杀螨剂性能的化合物。或者，本发明的化合物可与其它这些活性成分顺序使用。

可与该化合物混合的杀真菌剂包括酰基苯胺类，如甲霜灵、啉霜灵、甲呋酰胺、苯霜灵和呋霜灵；霜脲氰；代森锰锌；百菌清；灭菌丹；克菌丹；famoxadone；fenamidone；spiroxamine；氟啶胺；烯酰吗啉；strobilurins，

如 kresoxim-methyl、azoxystrobin 和 trifloxystrobin、pyrimethanil、cyprodinil; 啞菌胺和异菌脲。

- 这些化合物引用的名称是非专利通用名, 其化学结构可参见 1997 年由英国农作物保护协会出版的“杀虫剂手册”(第十一版)。在该杀虫剂手册中没有
5 列出通用名的化合物, 完整的化学名如下:

trifloxystrobin-	(E,E)-甲氧基亚氨基-{2-[1-(3-三氟甲基苯基)-亚乙基氨基氧甲基]苯基}乙酸甲酯
spiroxamine-	8-叔丁基-1,4-二氧杂螺[4,5]癸烷-2-基甲基(乙基)(丙基)胺
fenamidone-	(S)-1-苯胺基-4-甲基-2-甲硫基-4-苯基咪唑啉-5-酮

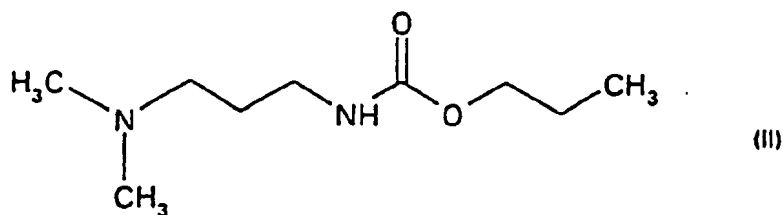
本发明的组合物例如可包含分散剂、乳化剂或湿润剂。它们通常是水浓缩液。

- 10 施用到植物上时, 本发明组合物中活性成分的浓度较好为 0.0001-1.0% 重量, 更好为 0.0001-0.01% 重量。在初级组合物中, 活性成分的量可以在较宽的范围变化, 例如占组合物的 5-95% 重量。

- 在本发明的方法中, 化合物一般施用到种子、植物或它们的生长环境中。因此, 本发明的化合物可以在播种前、播种时或播种后直接施用于土壤, 从而使土壤中存在的活性化合物能控制可能侵害种子的真菌的生长。当直接处理土壤时, 该活性化合物可用任何能让其与土壤充分混合的方法施用, 如喷雾法、
15 播撒固体颗粒、或在播种时同时施用活性成分。合适的施用量为 5-1000 克/公顷, 更好为 10-500 克/公顷。

- 在植物上开始出现真菌时, 或者在植物上出现真菌前作为保护措施, 例如
20 可用喷雾法或撒粉法将活性化合物直接施用在植物上。在这两种情况下, 优选的施用方式是叶面喷雾法。一般来说重要的是在植物生长的早期获得对真菌的良好防治, 因为这一时期植物损害最严重。如有必要, 喷雾剂或撒粉中一般含有萌前或萌后除草剂。有时, 宜在栽种前或栽种时处理植物的根, 例如将根浸在合适的液体或固体组合物中。当活性化合物直接施用于植物上时, 合适的施
25 用量为 0.025-5 千克/公顷, 较好为 0.05-1 千克/公顷。

式 I 的化合物可通过使式 II 的胺



与磷酸氢乙酯反应制得。

反应可以在水溶液中进行。

5 下面参照实施例说明本发明。

实施例 1

将磷酸氢乙酯钠盐的溶液(13.2 克钠盐溶解于 25 毫升的水中)加入 3-(二甲氨基)丙基氨基甲酸丙酯盐酸盐的水溶液中(31.0 毫升, 浓度为 722 克/升, 10 0.1 摩尔)。将该溶液蒸发至干, 留下含白色氯化钠固体的油状物。将该粗产物与二氯甲烷(约 100 毫升)研制, 过滤掉不溶解的白色固体(氯化钠), 用几份二氯甲烷洗涤。合并滤液, 蒸发后留下 O-乙基磷酸二甲基[3-(丙氧基羰基氨基)丙基]铵, 为粘性无色油状物。

15 通过观察相对于 3-(二甲氨基)丙基氨基甲酸丙酯的化学位移, NMR 光谱确认是盐。

原料通过用已知的方法碱性水解亚磷酸二乙酯制得。例如参见合成 (Synthesis) 134, 1978。

实施例 2

20 用手动喷雾器在试验的葡萄树上喷雾各种浓度的实施例 1 化合物的水溶液。然后用手动喷雾器喷雾每毫升含 100000 个葡萄生单轴霉孢子的孢子悬浮液, 对该植物进行接种。为了进行比较, 也在葡萄树上喷洒市售的丙酰胺(propamocarb)盐酸盐。

与未防治的植物相比, 评价病害控制程度。

结果如下：

防治剂	浓度 (ppm)	%控制
本发明的化合物	800	81.5
本发明的化合物	400	27.6
丙酰胺盐酸盐	800	14.6
丙酰胺盐酸盐	400	4.2